

JP1997221476A

1997-8-26

Bibliographic Fields

Document Identity

(19)【発行国】

日本国特許庁(JP)

(12)【公報種別】

公開特許公報(A)

(11)【公開番号】

特開平9-221476

(43)【公開日】

平成9年(1997)8月26日

(19) [Publication Office]

Japan Patent Office (JP)

(12) [Kind of Document]

Unexamined Patent Publication (A)

(11) [Publication Number of Unexamined Application]

Japan Unexamined Patent Publication Hei 9- 221476

(43) [Publication Date of Unexamined Application]

1997 (1997) August 26*

Public Availability

(43)【公開日】

平成9年(1997)8月26日

(43) [Publication Date of Unexamined Application]

1997 (1997) August 26*

Technical

(54)【発明の名称】

医薬組成物

(51)【国際特許分類第 6 版】

C07D223/16

A61K 31/55 ABU

AED

C07D243/12

243/14

401/06 223

401/10 243

401/12 223

401/14 223

403/10 209

223

403/12 223

405/12 223

409/06 223

413/10 223

243

417/06 223

417/10 223

(54) [Title of Invention]

PHARMACEUTICAL COMPOSITION

(51) [International Patent Classification, 6th Edition]

C07D223/16

A61K31 /55ABU

AED

C07D243/12

243/14

401/06223

401/10243

401/12223

401/14223

403/10209

223

403/12223

405/12223

409/06223

413/10223

243

417/06223

417/10223

JP1997221476A

1997-8-26

471/04 108

471/04108

【FI】

[FI]

C07D223/16 A

C07D223/16A

A61K 31/55 ABU

A61K31 /55ABU

AED

AED

C07D243/12

C07D243/12

243/14

243/14

401/06 223

401/06223

401/10 243

401/10243

401/12 223

401/12223

401/14 223

401/14223

403/10 209

403/10209

223

223

403/12 223

403/12223

405/12 223

405/12223

409/06 223

409/06223

413/10 223

413/10223

243

243

417/06 223

417/06223

417/10 223

417/10223

471/04 108 A

471/04108A

【請求項の数】

[Number of Claims]

4

4

【出願形態】

[Form of Application]

FD

FD

【全頁数】

[Number of Pages in Document]

646

646

Filing

【審査請求】

[Request for Examination]

未請求

Unrequested

(21)【出願番号】

(21) [Application Number]

特願平8-354761

Japan Patent Application Hei 8- 354761

(22)【出願日】

(22) [Application Date]

平成8年(1996)12月16日

1996 (1996) December 16*

Foreign Priority

(31)【優先権主張番号】

特願平7-348123

(32)【優先日】

平7(1995)12月15日

(33)【優先権主張国】

日本(JP)

(31) [Priority Application Number]

Japan Patent Application Hei 7- 348123

(32) [Priority Date]

7 (1995) December 15

(33) [Priority Country]

Japan (JP)

Parties**Applicants**

(71)【出願人】

【識別番号】

000206956

【氏名又は名称】

大塚製薬株式会社

【住所又は居所】

東京都千代田区神田司町2丁目9番地

(71) [Applicant]

[Identification Number]

000206956

[Name]

**OTSUKA PHARMACEUTICAL CO. LTD. (DN
69-054-8318)**

[Address]

Tokyo Chiyoda-ku Kanda Tsukasamachi 2-Chome 9address

Inventors

(72)【発明者】

【氏名】

小川 英則

【住所又は居所】

徳島県板野郡松茂町中喜来字中瀬西ノ越25番地の18

(72)【発明者】

【氏名】

近藤 一見

【住所又は居所】

徳島県板野郡松茂町中喜来字稲本55番地の11

(72)【発明者】

【氏名】

山下 博司

【住所又は居所】

東京都文京区湯島4丁目5-11 堀内ビル202号

(72) [Inventor]

[Name]

Ogawa Hidenori

[Address]

Tokushima Prefecture Itano-gun Matsushigecho ****Nakase
* [no] *25address *18

(72) [Inventor]

[Name]

Kondo **

[Address]

Tokushima Prefecture Itano-gun Matsushigecho ****Inamoto
55address *11

(72) [Inventor]

[Name]

Yamashita Hiroshi

[Address]

Tokyo Bunkyo-ku Yushima 4-Chome 5- 11Horiuchi building
202*

JP1997221476A

1997-8-26

(72)【発明者】

【氏名】

菅 慶三

【住所又は居所】

徳島県徳島市川内町金岡5番2

(72) [Inventor]

[Name]

[Address]

Tokushima Prefecture Tokushima City Kawachi-machi gold
Oka 5-2

(72)【発明者】

【氏名】

松崎 敬之

【住所又は居所】

徳島県徳島市南島田町2丁目89番地105号

(72) [Inventor]

[Name]

Matsusaki Takayuki

[Address]

Tokushima Prefecture Tokushima City *Shimada *2-Chome
89address 105*

(72)【発明者】

【氏名】

篠原 友一

【住所又は居所】

徳島県鳴門市撫養町小桑島字前浜140番地
サンヴィレッチ605号室

(72) [Inventor]

[Name]

Shinohara Tomokazu

[Address]

Tokushima Prefecture Naruto City Muyacho *Kuwanima
*Maehama 140address [sanvurejji] 605**

(72)【発明者】

【氏名】

棚田 喜久

【住所又は居所】

徳島県鳴門市撫養町齊田字東発19番3

(72) [Inventor]

[Name]

Tanada **

[Address]

Tokushima Prefecture Naruto City Muyacho *****19*3

(72)【発明者】

【氏名】

栗村 宗明

【住所又は居所】

徳島県鳴門市撫養町小桑島字前浜252番地
鳴門グランドハイツ503号室

(72) [Inventor]

[Name]

Kurimura Muneaki

[Address]

Tokushima Prefecture Naruto City Muyacho *Kuwanima
*Maehama 252address Naruto ground Heights 503**

(72)【発明者】

【氏名】

富永 道明

【住所又は居所】

徳島県板野郡上板町高磯310番地の6

(72) [Inventor]

[Name]

Tominaga Michiaki

[Address]

Tokushima Prefecture Itano-gun top plate ***31 0 *6

(72)【発明者】

【氏名】

(72) [Inventor]

[Name]

藪内 洋一

【住所又は居所】

徳島県徳島市川内町大松900番地の25

**Yoichi

[Address]

Tokushima Prefecture Tokushima City Kawachi-machi *pine
900address *25

Agents

(74)【代理人】

【弁理士】

【氏名又は名称】

三枝 英二 (外4名)

(74) [Attorney(s) Representing All Applicants]

[Patent Attorney]

[Name]

Saegusa Eiji (*4 persons)

Abstract

(57)【要約】

(修正有)

【課題】

本発明は、バソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤、バソプレシン作動剤等として有用な医薬組成物を提供することを目的とする。

【解決手段】

本発明の医薬組成物中に含有されるベンゾヘテロ環誘導体は、一般式(1)で代表される化合物である。

(57) [Abstract]

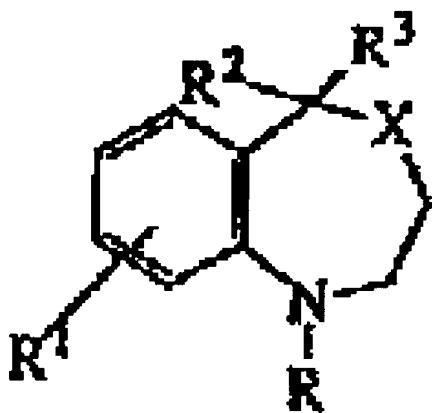
(There is an amendment.)

[Problems to be Solved by the Invention]

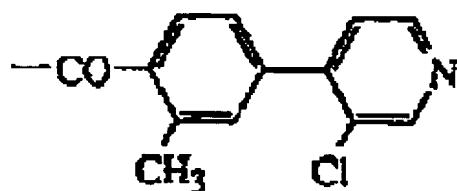
this invention designates that useful pharmaceutical composition is offered as vasopressin antagonist, oxytocin antagonist, vasopressin operation agent etc as objective.

[Means to Solve the Problems]

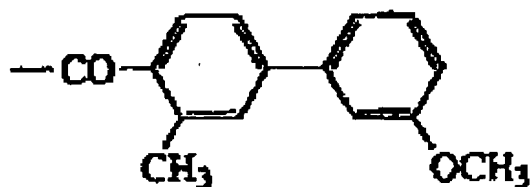
benzo heterocyclic derivative which is contained in pharmaceutical composition of this invention is compound which is represented with General Formula (1).



(1)



(2)



(3)

[式中、X は-CH₂-, =CH-, -NR¹⁴(R¹⁴:水素原子、低級アルキル基等)または単結合を示し、R₁ は水素原子、ハロゲン原子等を示し、R² は水素原子等を示し、R³ は水素原子、-CH₂COOR¹⁵(R¹⁵:水素、低級アルキル基等)等を示し、R は式(2)、式(3)等の基を示す]

{In Formula, X -CH₂-, =CH-, -NR¹⁴ (R¹⁴:hydrogen atom, lower alkyl group etc) or shows single bond, R₁ shows hydrogen atom, halogen atom etc, R² shows hydrogen atom etc, R³ shows the hydrogen atom, -CH₂COOR¹⁵ (R¹⁵:hydrogen, lower alkyl group etc) etc, R shows Formula (2), Formula (3) or other group }

Claims

【特許請求の範囲】

[Claim (s)]

【請求項 1】

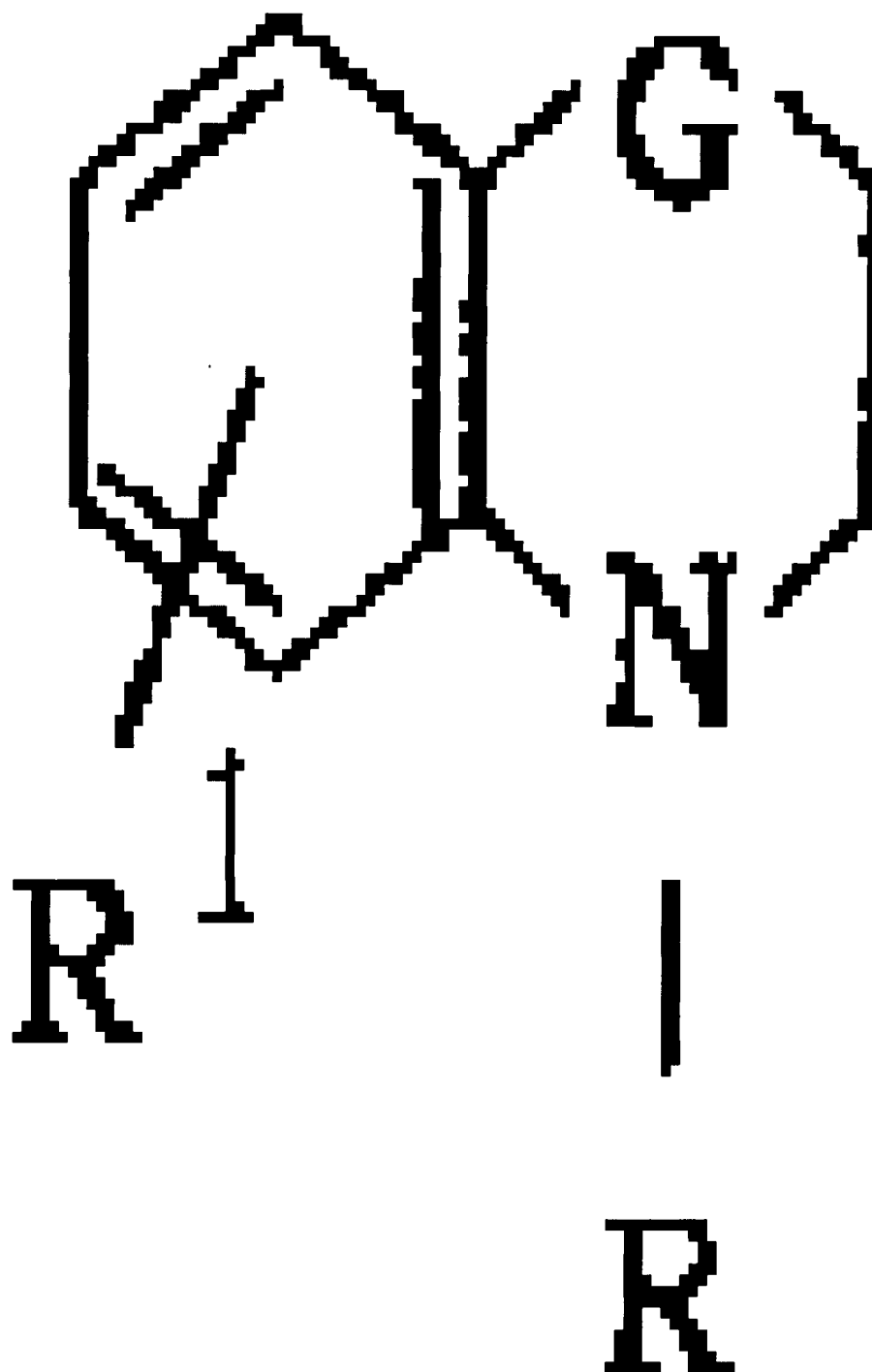
[Claim 1]

一般式

General Formula

【化 1】

[Chemical Formula 1]

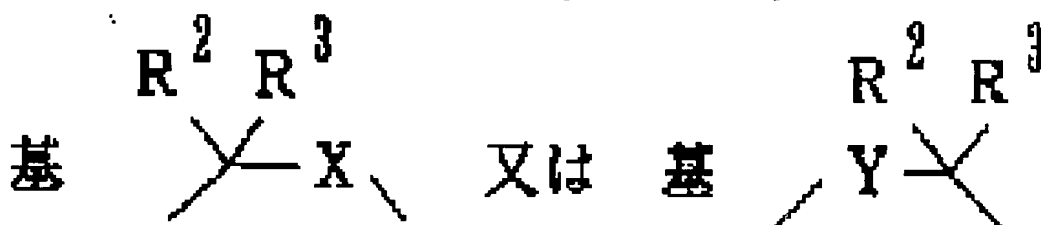


〔式中 G は〕

{As for G in Formula }

【化 2】

[Chemical Formula 2]



を示す。

R¹ は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。

R² は、基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は、同一又は異なつて、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。); 水素原子; 水酸基; 低級アルコキシ基; カルボキシ置換低級アルキル基; シアノ置換低級アルキル基; テトラゾリル基置換低級アルキル基; 低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基; 低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基; 置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基; 低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基; カルボキシ基置換低級アルコキシ基; 低級アルカノイル基; 又は基-(O)_m-A-(CO)_uNR⁶R⁷(m 及び u はそれぞれ 0 又は 1 を示す。但し m 及び u は同時に 0 であつてはならない。A は低級アルキレン基を示す。R⁶ 及び R⁷ は同一又は異なつて、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R⁶ 及び R⁷ は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく 5-7 員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換してい

It shows.

R¹ shows amino carbonyl lower alkoxy group which has fact that it possesses the lower alkyl group as amino group, carboxy substitution lower alkoxy group, lower alkoxy carbonyl substitution lower alkoxy group or substituent which has times when it possesses lower alkyl group as amino lower alkoxy group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and lower alkanoyl group as hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, substituent.

R² amino substitution lower alkanoyl oxy group; lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group; carboxyl substitution lower alkoxy group; lower alkanoyl group; or basis which has times when it possesses lower alkyl group basis -NR⁴R⁵ (R⁴ and R⁵ show benzoyl group which has fact that it possesses halogen atom as substituent on lower alkyl group or phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group as alike or different, hydrogen atom, substituent.); as hydrogen atom; hydroxy group; lower alkoxy group; carboxy substituted lower alkyl group; cyano substituted lower alkyl group; tetrazolyl group substituted lower alkyl group; lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group; lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group; substituent - shows (O)_m-A-(CO)_uNR⁶R⁷ (m and u show 0 or 1 respectively. However m or u with 0 do not become simultaneous. A shows lower alkylene group. R⁶ and R⁷ show phenyl group which has fact that it possesses halogen atom on amino substituted lower alkyl group, carbamoyl group substituted lower alkyl group, adamantyl group substituted lower alkyl group, lower alkyl sulfonyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as alike or different, hydrogen atom, lower alkoxy group, lower alkyl group, substituent. R⁶ and R⁷ with nitrogen atom which these connect through the nitrogen atom or oxygen atom or 5-7-member ring may form saturated heterocycle without minding. On said heterocycle,

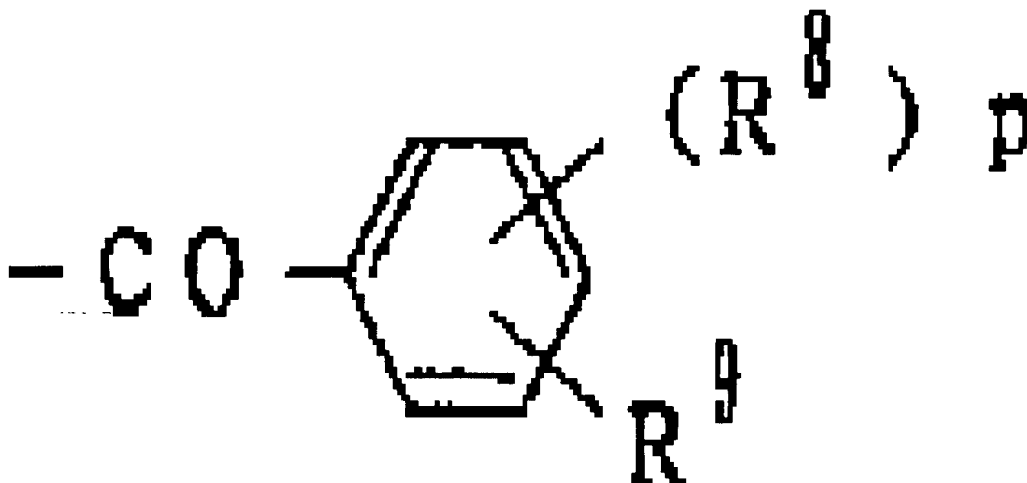
てもよい。)を示す。

R³ は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。

また R² と R³ とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。

R は、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基;シクロアルキルカルボニル基又は基

【化 3】



(p は 1 又は 2 を示す。R⁸ は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R⁹ は、基-NR¹⁰R¹¹(R¹⁰ は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R¹¹ は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基な

group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and phenyl lower alkyl group optionally substitutable .).

R^³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group .

In addition R^² and R^³, these becoming simultaneous, the oxo group , lower alkylidene group , lower alkoxy-substituted lower alkylidene group , lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group , or it is possible to form phenyl substitution lower alkylidene group .

As for R, On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Which have times when it possesses phenyl group as substituent thegroup which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has times when itpossesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has timeswhen it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent thiazolyl carbonyl group ;cycloalkyl carbonyl group or basis

[Chemical Formula 3]

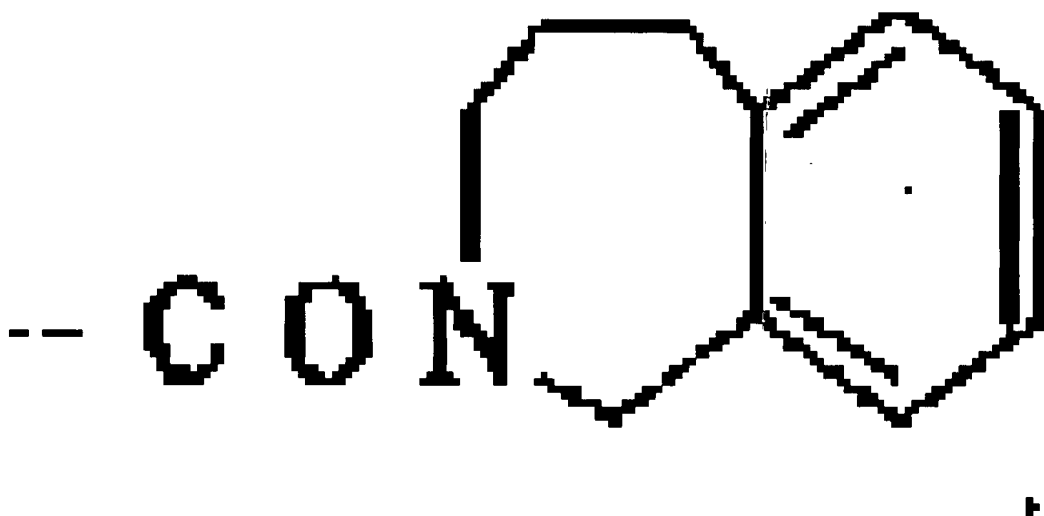
p shows 1 or 2 . R^⁸ shows amino group , nitro group , halogen atom or lower alkoxy group which has times when itpossesses lower alkanoyl group as hydrogen atom , lower alkyl group , hydroxy group , substituent . As for R^⁹, basis -NR^{¹⁰}R^{¹¹} (R^{¹⁰} shows lower alkanoyl group which has fact that it possesses the halogen atom hydrogen atom , lower alkyl group or as substituent . As for R^{¹¹} from

る群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基))

【化 4】

group which becomes halogen atom and hydroxy group as lower alkyl group, substituent on lower alkanoyl group, cycloalkyl group, phenyl ring which has times when it possesses the group which is chosen there are times when it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and halogen atom as substituent, and On phenyl lower alkyl group, phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group in the lower alkyl group portion on phenoxy lower alkyl group, phenyl ring which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent as substituent there are times when it possesses group which is chosen from group which becomes amino group, nitro group, lower alkanoyl group substituted amino group and halogen atom which have times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group, phenyl group, lower alkoxy group, halogen atom substituted lower alkyl group, substituent, and In lower alkanoyl group portion lower alkoxy carbonyl group, lower alkoxy-substituted lower alkanoyl group, lower alkanoyl oxy substitution lower alkanoyl group, phenoxy lower alkoxy carbonyl group, benzo furil carbonyl group, benzoimidazolyl carbonyl group; quinolyl carbonyl group, quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, phenyl lower alkoxy carbonyl group, basis which has times when it possesses halogen atom as amino carbonyl group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group, pyridyl lower alkyl group and phenyl lower alkyl group as phenoxy lower alkanoyl group, substituent which has fact that it possesses halogen atom as substituent)

[Chemical Formula 4]



、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、ベンゾ

On tetrahydroisoquinolyl carbonyl group, benzoyl lower

イル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリンオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。

また R^{10} 及び R^{11} は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。

);

水素原子;

低級アルカノイルオキシ基;

低級アルカノイル基;

低級アルコキシ基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基;

シクロアルキル基;

低級アルキル基;

低級アルキルチオ基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基;フェノキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有するこ

alkyl group, quinoline ring from group which becomes lower alkyl group and oxo group as substituent on tetrahydro quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, lower alkyl sulfonyl group, pyridyl lower alkoxy carbonyl group, fluorenyl lower alkoxy carbonyl group, lower alkenyl oxycarbonyl group, tetrahydro naphthyloxy substitution lower alkanoyl group, phenyl lower alkenyl carbonyl group, piperidine ring which has times when it possesses group which is chosen bipyridinyl lower alkoxy carbonyl group which has fact that it possesses group which is chosen is shown from group which becomes lower alkanoyl group, lower alkoxy carbonyl group and lower alkyl group as substituent.

In addition R^{10} and R^{11} with nitrogen atom which these connect may form isoindoline ring.

);

hydrogen atom;

lower alkanoyl oxy group;

lower alkanoyl group;

lower alkoxy group;

On phenyl ring benzoyl group; which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

cycloalkyl group;

lower alkyl group;

lower alkyl thio group;

On phenyl ring phenyl lower alkanoyl group; which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

On phenyl ring as substituent amino group, phenyl group which has times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group, lower alkoxy group, phenyl lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, halogen atom substitution lower alkoxy group, nitro group, substituent and From group which becomes amino substitution lower alkoxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group; phenoxy group; phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on phenoxy lower alkyl group; phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on the phenyl lower alkyl group; phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent the times when it possesses lower alkyl group as substituent it is On anilino lower alkyl group; phenyl ring as halogen atom, lower alkoxy carbonyl group and substituent as substituent lower alkyl group and From group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when it possesses lower alkyl group as

とのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基;ピロリジニル置換低級アルコキシ基;窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1~4 個有する飽和もしくは不飽和の 5~11 員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を 1~3 個有していてもよい);シクロアルケニル基;フェニル低級アルキルアミノカルボニル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基;シアノ基;又は基-(A)m-CHR¹²R¹³(A は前記に同じ。R¹² は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。m は 0 又は 1 を示す。)を示す。

。)

X はメチレン基、単結合、基=CH-又は基-NR¹⁴-(R¹⁴ は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。

Y は-NR^A-を示す(R^A は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基-ACONR^BR^Cを示す。ここでR^B及びR^Cは、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこのR^B及びR^Cは、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して 5~7 員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す。

但し、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵が同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。)、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基-(O)m-A-(CO)_nNR⁶R⁷(m は 1、u は 0

substituent from group which becomes the amino carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen on phenyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on benzoyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent on phenyl lower alkenyl group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent as substituent lower alkyl group it possesses amino sulfonyloxy group ;cyano group ; or basis which has times when it possesses lower alkyl group monocycle of 5 - 11 member rings of saturated or unsaturated which 1 - 4 possesses benzoyl lower alkyl group ;pyrrolidinyl substitution lower alkoxy group ;nitrogen atom , oxygen atom or sulfur atom which has thing or heterocyclic group of binary ring (As substituent becomes lower alkyl group , phenyl group , lower alkanoyl group , halogen atom , phenyl lower alkyl group and oxo group 1 - 3 it is possible to said heterocyclic group to have possessed group which is chosen from group which); as cycloalkenyl group ;phenyl lower alkyl amino carbonyl group ;substituent - (A) m-CHR¹²R¹³ (As for A same to description above. R¹² shows hydrogen atom , hydroxy group or lower alkanoyl oxy group . R¹³ on phenyl ring shows phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent . m shows 0 or 1 .) is shown.

).

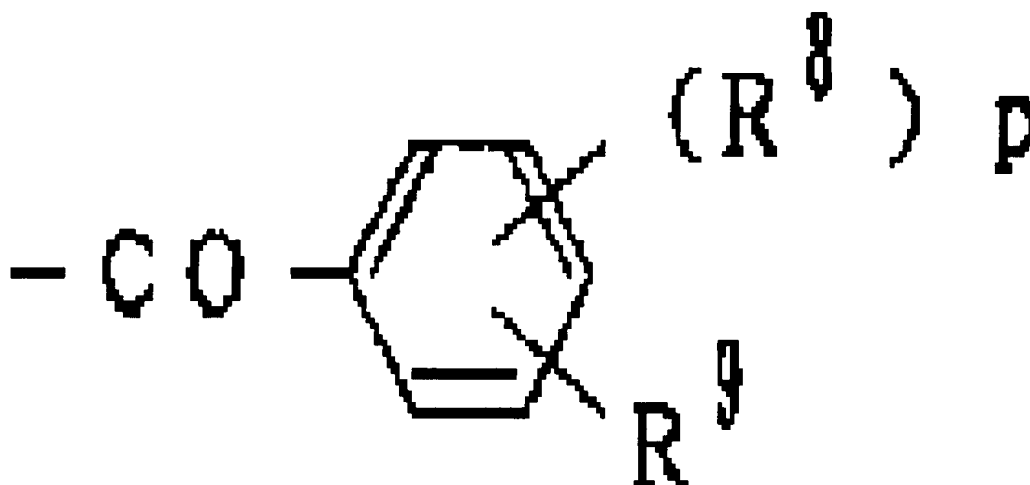
X methylene group , single bond , basis =CH- or basis -NR¹⁴- shows (R¹⁴ shows hydrogen atom , lower alkyl group or lower alkanoyl group .)

Y shows (hydrogen atom , lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group , carboxy substituted lower alkyl group or basis -ACONR^BR^C it shows R^A. R^B and R^C show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group here. In addition this R^B and R^C with nitrogen atom which these connect through nitrogen atom or oxygen atom or connecting mutually without minding, 5 - 7 -member ring may form saturated heterocycle . On said heterocycle lower alkyl group optionally substitutable .) which -NR^A- is shown.

As for m 1, as for u 0 or 1 are shown. 5 - 6 -member ring saturated heterocycle is formed without R⁶ and R⁷ show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group , or R⁶ and R⁷ with nitrogen atom which these connect through nitrogen atom or oxygen atom or minding (On said heterocycle lower alkyl group optionally substitutable) , Or amino substitution lower

又は 1 を示す。R⁶ 及び R⁷ が同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示すか、R⁶ 及び R⁷ がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく 5-6 員環の飽和複素環を形成する(該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい)、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基;又は R² と R³ が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する;R が基

【化 5】



であって、R⁸ が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、R⁹ は水素原子であってはならないし、また R⁹ が基-NR¹⁰R¹¹ であって且つ R¹¹ が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を 1-3 個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であってはならない。

また R¹ が水素原子で、R² が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミノ基であるか、或いは R² と R³ とが一緒になってオキシ基を形成するとき、R⁹ はフェニル環上に置換基として水酸基、低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはならない。

alkanoyl oxy group ; or R² and R³ which have times when it possesses lower alkyl group as substituent becoming simultaneous, forms oxo group or lower alkylidene group ; R basis However, R² basis -NR⁴R⁵ (R⁴ and R⁵ show alike or different , hydrogen atom , lower alkyl group or benzoyl group .), hydrogen atom , hydroxy group , lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group , carboxyl substitution lower alkoxy group , lower alkoxy group , lower alkanoyl oxy group . substituted lower alkyl group , basis - (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷

[Chemical Formula 5]

When so, R⁸ shows hydrogen atom , lower alkyl group , hydroxy group , halogen atom , lower alkoxy group or amino group respectively, the R⁹ does not become with hydrogen atom and, in addition R⁹ basis-NR¹⁰R¹¹, and R¹¹ on lower alkanoyl group , phenyl lower alkoxy carbonyl group or phenyl ring with phenoxy lower alkanoyl group which has fact that 1 - 3 it possesses group which is chosen does not become from group which becomes lower alkyl group , amino group , lower alkanoyl group substituted amino group and lower alkoxy group as the substituent .

In addition R¹ being hydrogen atom , R² is hydrogen atom , amino group , mono lower alkyl amino group or the di lower alkyl amino group , or or R² and R³ become simultaneous and when forming oxo group , R⁹ with phenyl group which has fact that it possesses hydroxy group , lower alkyl group , lower alkoxy group or lower alkanoyl oxy group as substituent does not become on the

JP1997221476A

1997-8-26

ない。

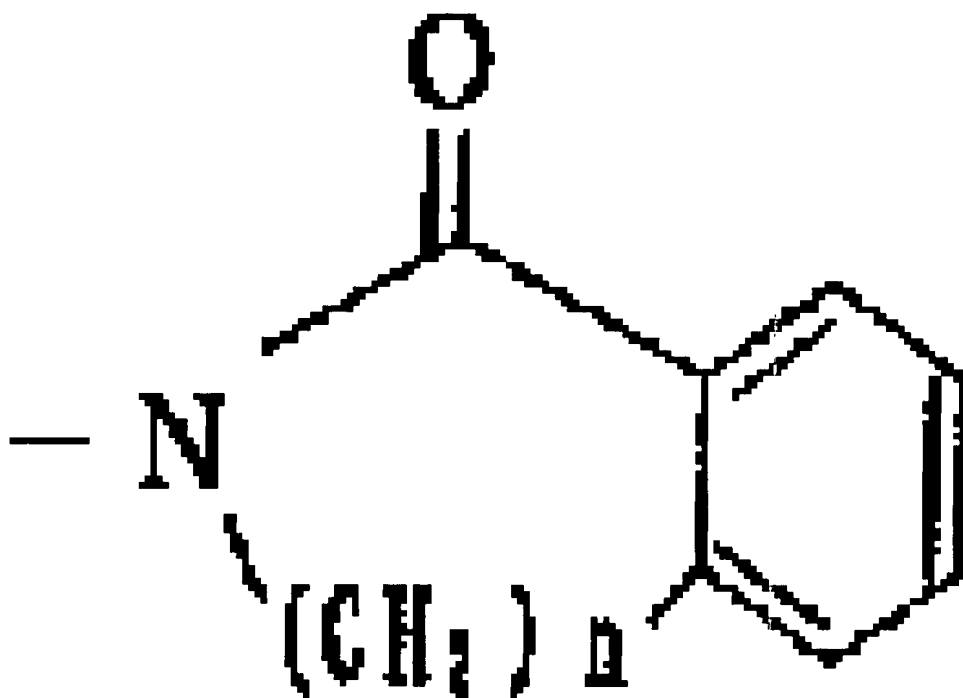
また R⁹ が基

【化 6】

phenyl ring .

In addition R⁹ basis

[Chemical Formula 6]

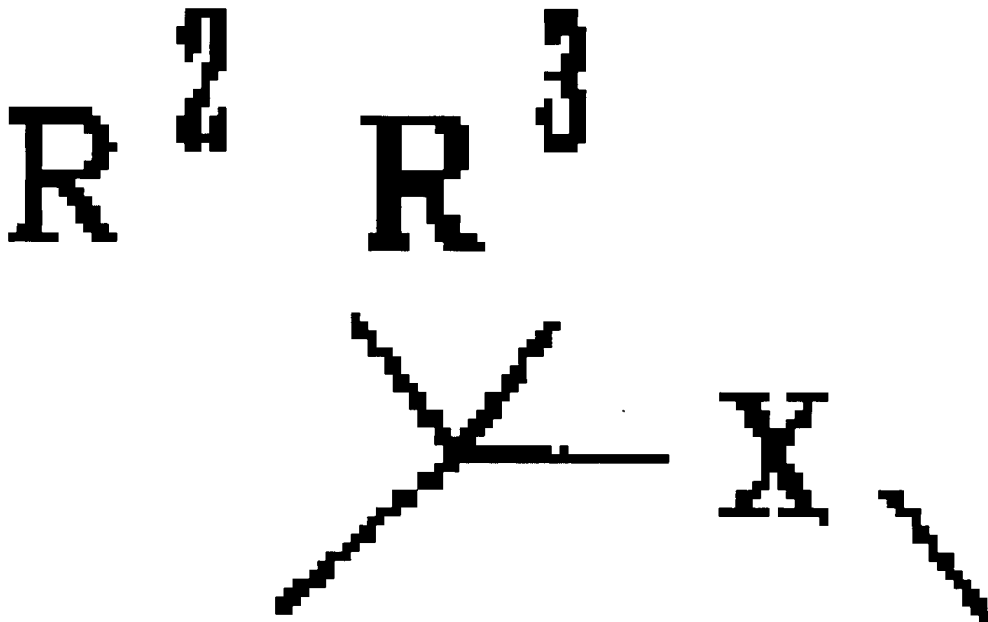


(n は 1 又は 2 を示す)、G が基

【化 7】

(n shows 1 or 2 .) G basis

[Chemical Formula 7]



(R^2 及び R^3 は前記に同じ)を示すとき、X はメチレン基又は基=CH-であってはならない。

また R^{10} 及び R^{11} は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはならない。

また R^1 及び R^2 が同時に水素原子を示すとき、R は無置換のピリジルカルボニル基、無置換のチエニルカルボニル基、無置換のチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基であってはならない。

更に R^3 が水素原子、 R^2 が水素原子、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ基、基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m が 1, u が 0 又は 1 を示す。 R^6 及び R^7 は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)又は基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)を示すか、又は R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を示すとき、 R^9 は基-NR¹⁰R¹¹(R^{10} は低級アルキル基、 R^{11} は低級アルキル基を示す。)、水素原子、低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基又は低級アルキル基であってはならない。

When showing (As for $R^{2²}$ and $R^{3³}$ same to description above), X does not become methylene group or with basis=CH-.

In addition as for $R^{10¹⁰}$ or $R^{11¹¹}$, when it is a hydrogen atom on onehand, as for other with lower alkyl group it does not become.

In addition when $R^{1¹}$ and $R^{2²}$ show hydrogen atom simultaneously, R does not become with unsubstituted pyridyl carbonyl group, unsubstituted thienyl carbonyl group, unsubstituted thiazolyl carbonyl group or cycloalkyl carbonyl group.

Furthermore $R^{3³}$ hydrogen atom, $R^{2²}$ amino substitution lower alkanoyl oxy group, lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkoxy group, basis which has times when it possesses the lower alkyl group as hydrogen atom, substituent - (O) m-A- (CO) uNR^{6⁶}R^{7⁷} (m 1, u 0 or 1 are shown. $R^{6⁶}$ and $R^{7⁷}$ show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group.) or basis -NR^{4⁴}R^{5⁵} shows($R^{4⁴}$ and $R^{5⁵}$ show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group.), or or $R^{2²}$ and $R^{3³}$ become simultaneous and when showing oxo group or lower alkylidene group, $R^{9⁹}$ does not become basis -NR^{10¹⁰}R^{11¹¹} (As for $R^{10¹⁰}$ as for lower alkyl group, $R^{11¹¹}$ lower alkyl group is shown.), with hydrogen atom, lower

JP1997221476A

1997-8-26

]で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも 1 種を含有する医薬組成物。

【請求項 2】

一般式

【化 8】

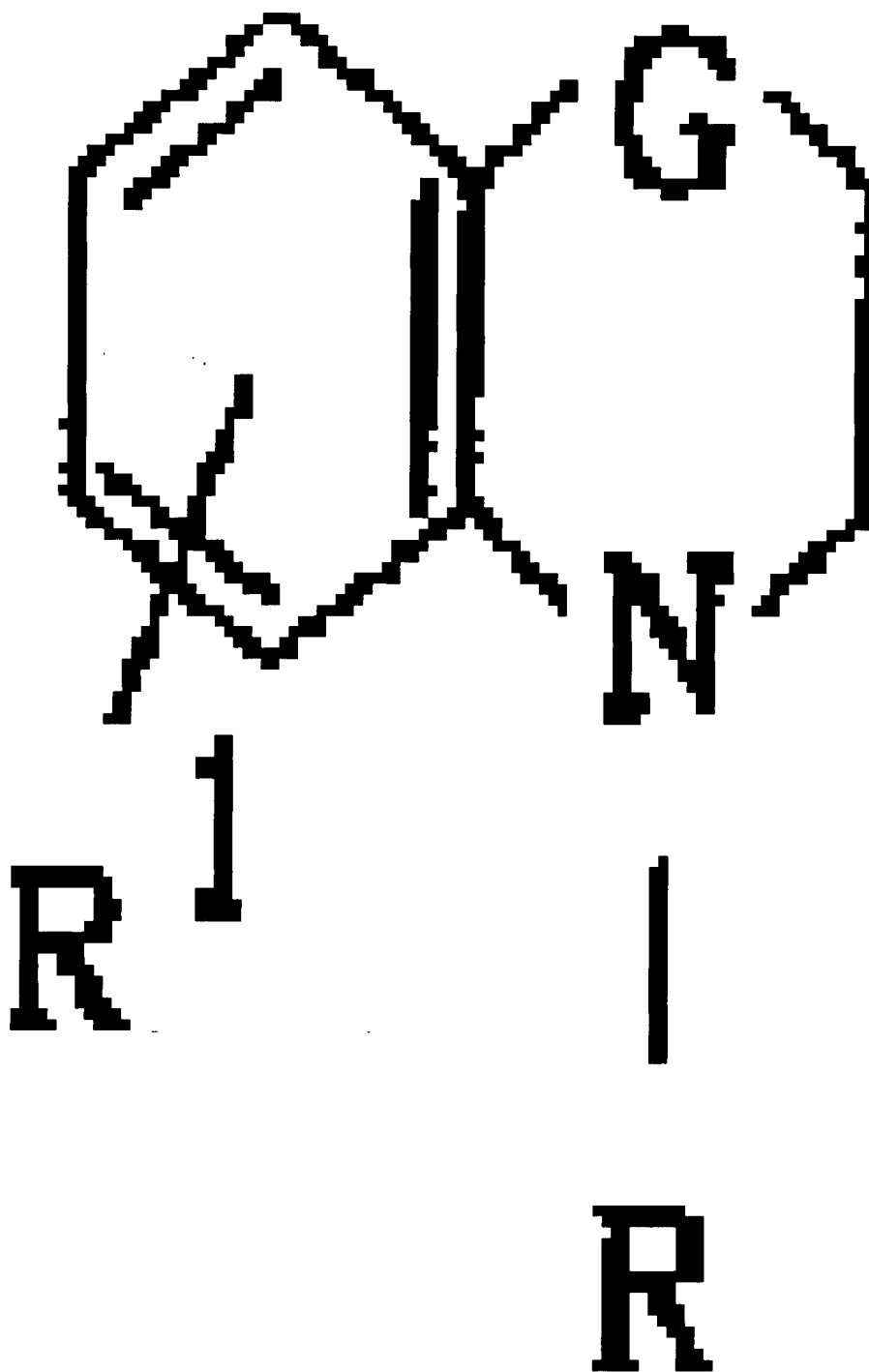
alkyl thio group , lower alkoxy group or lower alkyl group .

) With pharmaceutical composition . which contains at least 1 kind which is chosen from the benzo heterocyclic derivative and its salt which is displayed

[Claim 2]

General Formula

[Chemical Formula 8]

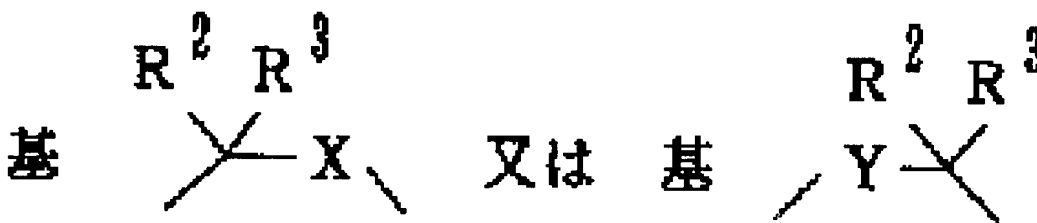


[式中 G は]

{As for G in Formula }

【化 9】

[Chemical Formula 9]



を示す。

R¹ は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。

R² は、基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。); 水素原子; 水酸基; 低級アルコキシ基; カルボキシ置換低級アルキル基; シアノ置換低級アルキル基; テトラゾリル基置換低級アルキル基; 低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基; 低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基; 置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基; 低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基; カルボキシ置換低級アルコキシ基; 低級アルカノイル基; 又は基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m 及び u はそれぞれ 0 又は 1 を示す。但し m 及び u は同時に 0 であってはならない。A は低級アルキレン基を示す。R⁶ 及び R⁷ は同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R⁶ 及び R⁷ は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく 5~7 員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換してい

It shows.

R¹ shows amino carbonyl lower alkoxy group which has fact that it possesses the lower alkyl group as amino group, carboxy substitution lower alkoxy group, lower alkoxy carbonyl substitution lower alkoxy group or substituent which has times when it possesses lower alkyl group as amino lower alkoxy group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and lower alkanoyl group as hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, substituent.

R² amino substitution lower alkanoyl oxy group; lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group; carboxyl substitution lower alkoxy group; lower alkanoyl group; or basis which has times when it possesses lower alkyl group basis -NR⁴R⁵ (R⁴ and R⁵ show benzoyl group which has fact that it possesses halogen atom as substituent on lower alkyl group or phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group as alike or different, hydrogen atom, substituent.); as hydrogen atom; hydroxy group; lower alkoxy group; carboxy substituted lower alkyl group; cyano substituted lower alkyl group; tetrazolyl group substituted lower alkyl group; lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group; lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group; substituent - shows (O) m-A-(CO) uNR⁶R⁷ (m and u show 0 or 1 respectively. However m or u with 0 do not become simultaneous. A shows lower alkylene group. R⁶ and R⁷ show phenyl group which has fact that it possesses halogen atom on amino substituted lower alkyl group, carbamoyl group substituted lower alkyl group, adamantyl group substituted lower alkyl group, lower alkyl sulfonyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as alike or different, hydrogen atom, lower alkoxy group, lower alkyl group, substituent. R⁶ and R⁷ with nitrogen atom which these connect through the nitrogen atom or oxygen atom or 5 - 7 - member ring may form saturated heterocycle without minding. On said heterocycle,

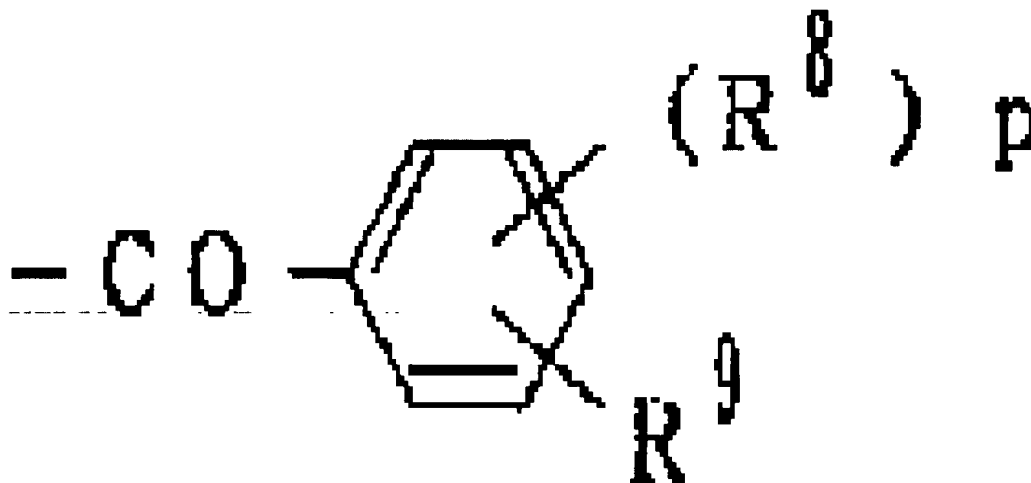
てもよい。)を示す。

R³ は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。

また R² と R³ とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。

R は、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基;シクロアルキルカルボニル基又は基

【化 10】



(p は 1 又は 2 を示す。R⁸ は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R⁹ は、基-NR¹⁰R¹¹(R¹⁰ は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R¹¹ は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基な

group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and phenyl lower alkyl group optionally substitutable .).

R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group .

In addition R² and R³, these becoming simultaneous, the oxo group , lower alkylidene group , lower alkoxy-substituted lower alkylidene group , lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group , or it is possible to form phenyl substitution lower alkylidene group .

As for R, On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Which have times when it possesses phenyl group as substituent thegroup which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has times when itpossesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has timeswhen it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent thiazolyl carbonyl group ;cycloalkyl carbonyl group or basis

[Chemical Formula 10]

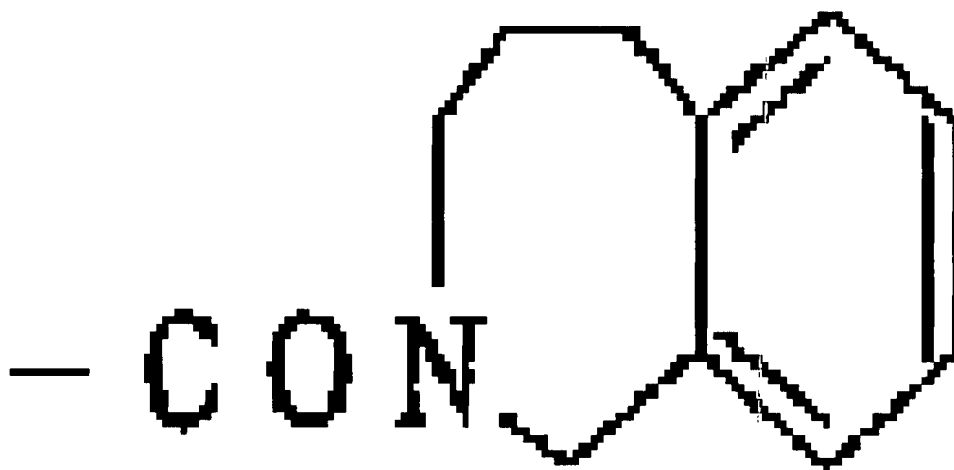
p shows 1 or 2 . R⁸ shows amino group , nitro group , halogen atom or lower alkoxy group which has times when itpossesses lower alkanoyl group as hydrogen atom , lower alkyl group , hydroxy group , substituent . As for R⁹, basis -NR¹⁰R¹¹(R¹⁰ shows lower alkanoyl group which has fact that it possesses the halogen atom hydrogen atom , lower alkyl group or as substituent . As for R¹¹ from

る群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基))

【化 11】

group which becomes halogen atom and hydroxy group as lower alkyl group, substituent on lower alkanoyl group, cycloalkyl group, phenyl ring which has times when it possesses the group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and halogen atom as substituent, and On phenyl lower alkyl group, phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group in the lower alkyl group portion on phenoxy lower alkyl group, phenyl ring which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent as substituent there are times when it possesses group which is chosen from group which becomes amino group, nitro group, lower alkanoyl group substituted amino group and halogen atom which have times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group, phenyl group, lower alkoxy group, halogen atom substituted lower alkyl group, substituent, and In lower alkanoyl group portion lower alkoxy carbonyl group, lower alkoxy-substituted lower alkanoyl group, lower alkanoyl oxy substitution lower alkanoyl group, phenoxy lower alkoxy carbonyl group, benzo furil carbonyl group, benzoimidazolyl carbonyl group; quinolyl carbonyl group, quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, phenyl lower alkoxy carbonyl group, basis which has times when it possesses halogen atom as amino carbonyl group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group, pyridyl lower alkyl group and phenyl lower alkyl group as phenoxy lower alkanoyl group, substituent which has fact that it possesses halogen atom as substituent)

[Chemical Formula 11]



、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選

On tetrahydroisoquinolyl carbonyl group, benzoyl lower alkyl group, quinoline ring from group which becomes lower alkyl group and oxo group as substituent on tetrahydro

ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジニル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。

また R^{10} 及び R^{11} は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。

);

水素原子;

低級アルカノイルオキシ基;

低級アルカノイル基;

低級アルコキシ基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基;

シクロアルキル基;

低級アルキル基;

低級アルキルチオ基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基;フェノキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ

quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, lower alkyl sulfonyl group, pyridyl lower alkoxy carbonyl group, fluorenyl lower alkoxy carbonyl group, lower alkenyl oxycarbonyl group, tetrahydro naphthyloxy substitution lower alkanoyl group, phenyl lower alkenyl carbonyl group, piperidine ring which has times when it possesses group which is chosen bipyridinyl lower alkoxy carbonyl group which has fact that it possesses group which is chosen is shown from group which becomes lower alkanoyl group, lower alkoxy carbonyl group and lower alkyl group as substituent.

In addition R^{10} and R^{11} with nitrogen atom which these connect may form isoindoline ring.

);

hydrogen atom;

lower alkanoyl oxy group;

lower alkanoyl group;

lower alkoxy group;

On phenyl ring benzoyl group; which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

cycloalkyl group;

lower alkyl group;

lower alkyl thio group;

On phenyl ring phenyl lower alkanoyl group; which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

On phenyl ring as substituent amino group, phenyl group which has times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group, lower alkoxy group, phenyl lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, halogen atom substitution lower alkoxy group, nitro group, substituent and From group which becomes amino substitution lower alkoxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group; phenoxy group; phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on phenoxy lower alkyl group; phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on the phenyl lower alkyl group; phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent the times when it possesses lower alkyl group as substituent it is On anilino lower alkyl group; phenyl ring as halogen atom, lower alkoxy carbonyl group and substituent as substituent lower alkyl group and From group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent from group which becomes the amino carbonyl group which has times when it possesses group which is

基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基;ピロリジニル置換低級アルコキシ基;窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1~4 個有する飽和もしくは不飽和の 5~11 員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を 1~3 個有していてもよい);シクロアルケニル基;フェニル低級アルキルアミノカルボニル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基;シアノ基;又は基-(A)^m-CHR¹²R¹³(A は前記に同じ。R¹² は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。m は 0 又は 1 を示す。)を示す。

Y)。

X はメチレン基、単結合、基=CH-又は基-NR¹⁴-(R¹⁴ は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。

Y は-NR^A-を示す(R^A は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基-ACONR^BR^Cを示す。ここで R^B 及び R^C は、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこの R^B 及び R^C は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して 5~7 員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す。

但し、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ が同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。)、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基-(O)^m-A-(CO)^uNR⁶R⁷(m は 1、u は 0 又は 1 を示す。R⁶ 及び R⁷ が同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示すか、R⁶ 及

chosenon phenyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on benzoyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent on phenyl lower alkenyl group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent as substituent lower alkyl group it possesses amino sulfonyloxy group ;cyano group ; or basis which has times when it possesses lower alkyl group monocycle of 5 - 11 member rings of saturated or unsaturated which 1 - 4 possesses benzoyl lower alkyl group ;pyrrolidinyl substitution lower alkoxy group ;nitrogen atom , oxygen atom or sulfur atom which has thing or heterocyclic group of binary ring (As substituent becomes lower alkyl group , phenyl group , lower alkanoyl group , halogen atom , phenyl lower alkyl group and oxo group 1 - 3 it is possible to said heterocyclic group to have possessed group which is chosen from group which); as cycloalkenyl group ;phenyl lower alkyl amino carbonyl group ;substituent - (A) m-CHR^{¹²}R^{¹³} (As for A same to description above. R^{¹²} shows hydrogen atom , hydroxy group or lower alkanoyl oxy group . R^{¹³} on phenyl ring shows phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent . m shows 0 or 1 .) is shown.

Y)。

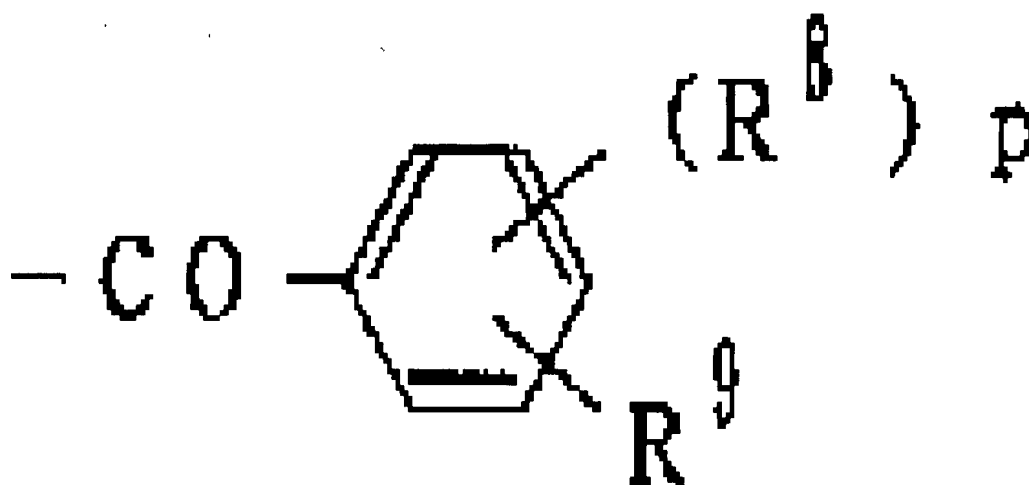
X methylene group , single bond , basis =CH- or basis -NR^{¹⁴}- shows (R^{¹⁴} shows hydrogen atom , lower alkyl group or lower alkanoyl group .) .

Y shows (hydrogen atom , lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group , carboxy substituted lower alkyl group or basis -ACONR^{^B}R^{^C} it shows R^{^A} , R^{^B} and R^{^C} show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group here. In addition this R^{^B} and R^{^C} with nitrogen atom which these connect through nitrogen atom or oxygen atom or connecting mutually without minding, 5 - 7 -member ring may form saturated heterocycle . On said heterocycle lower alkyl group optionally substitutable .) which -NR^{^A}- is shown.

As for m 1, as for u 0 or 1 are shown. 5 - 6 -member ring saturated heterocycle is formed without R^⁶ and R^⁷ show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group , or R^⁶ and R^⁷ with nitrogen atom which these connect through nitrogen atom or oxygen atom or minding (On said heterocycle lower alkyl group optionally substitutable) , Or amino substitution lower alkanoyl oxy group ; or R^² and R^³ which have times when it possesses lower alkyl group as

び R^7 がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく 5~6 員環の飽和複素環を形成する(該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい)、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基;又は R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する; R が基

[化 12]



であって、 R^8 が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、 R^9 は水素原子であってはならないし、また R^9 が基- $NR^{10}R^{11}$ であって且つ R^{11} が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を 1~3 個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であってはならない。

また R^1 が水素原子で、 R^2 が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミノ基であるか、或いは R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成するとき、 R^9 はフェニル環上に置換基として水酸基、低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはならない。

substituent becoming simultaneous, forms oxo group or lower alkylidene group ; R basis However, $R^{2/2}$ basis - $NR^{4/4}R^{5/5}$ ($R^{4/4}$ and $R^{5/5}$ show alike or different , hydrogen atom , lower alkyl group or benzoyl group .), hydrogen atom , hydroxy group , lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group , carboxyl substitution lower alkoxy group , lower alkoxy group , lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group , basis - (O) m-A- (CO) u $NR^{6/6}R^{7/7}$

[Chemical Formula 12]

When so, $R^{8/8}$ shows hydrogen atom , lower alkyl group , hydroxy group , halogen atom , lower alkoxy group or amino group respectively, the $R^{9/9}$ does not become with hydrogen atom and, in addition $R^{9/9}$ basis- $NR^{10/10}R^{11/11}$, and $R^{11/11}$ on lower alkanoyl group , phenyl lower alkoxy carbonyl group or phenyl ring with phenoxy lower alkanoyl group which has fact that 1 - 3 it possesses group which is chosen does not become from group which becomes lower alkyl group , amino group , lower alkanoyl group substituted amino group and lower alkoxy group as the substituent .

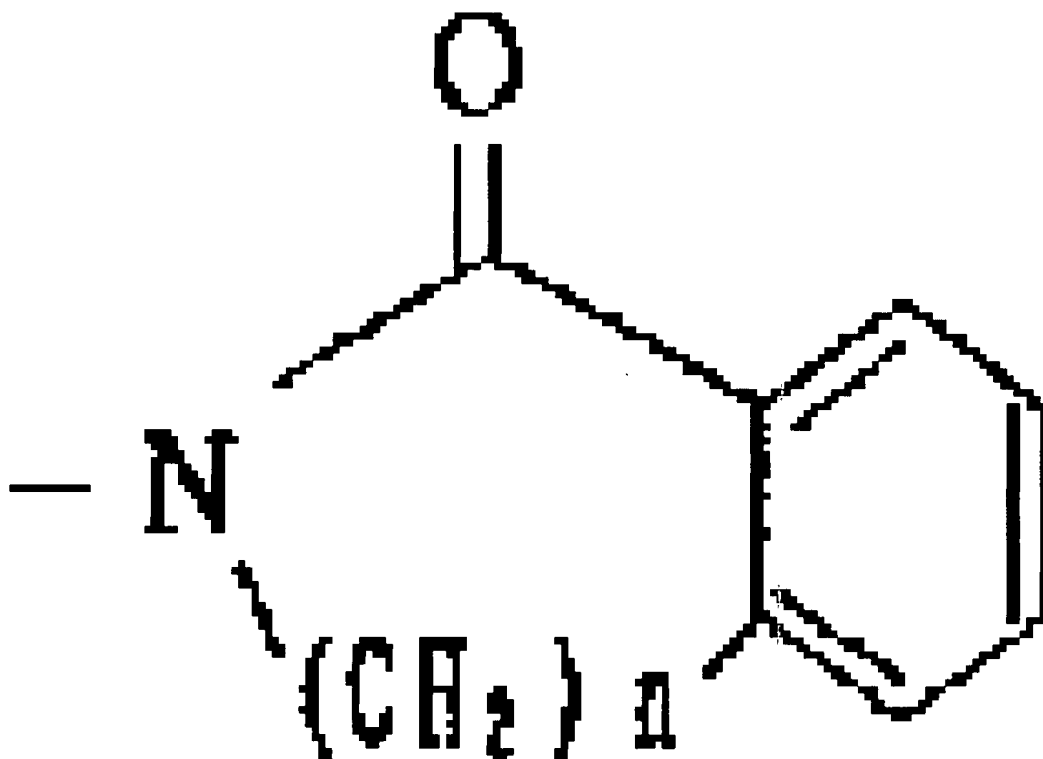
In addition $R^{1/1}$ being hydrogen atom , $R^{2/2}$ is hydrogen atom , amino group , mono lower alkyl amino group or the di lower alkyl amino group , or or $R^{2/2}$ and $R^{3/3}$ become simultaneous and when forming oxo group , $R^{9/9}$ with phenyl group which has fact that it possesses hydroxy group , lower alkyl group , lower alkoxy group or lower alkanoyl oxy group as substituent does not become on the phenyl ring .

JP1997221476A

1997-8-26

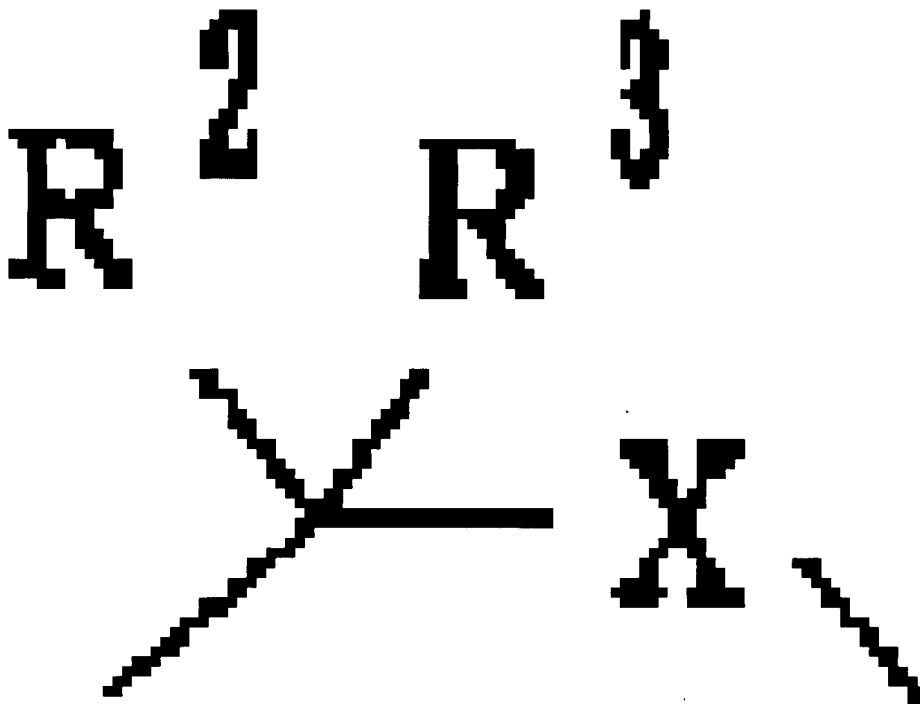
また R⁹ が基
【化 13】

In addition R⁹ basis
[Chemical Formula 13]



(n は 1 又は 2 を示す)、G が基
【化 14】

(n shows 1 or 2 .) G basis
[Chemical Formula 14]



(R^2 及び R^3 は前記に同じ)を示すとき、X はメチレン基又は基=CH-であってはならない。

更に R^{10} 及び R^{11} は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはならない。

]で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有するバソプレシン拮抗用医薬組成物。

【請求項 3】

請求項2に記載のベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有するオキシトシン拮抗用医薬組成物。

【請求項 4】

一般式

【化 15】

When showing (As for $R^{2</sup>2</sup>$ and $R^{3</sup>3</sup>$ same to description above), X does not become methylene group or with basis=CH-.

Furthermore as for $R^{10</sup>10</sup>$ or $R^{11</sup>11</sup>$, when it is a hydrogen atom on onehand, as for other with lower alkyl group it does not become.

) With pharmaceutical composition . for vasopressin competition which contains at least 1 kind which is chosen from benzo heterocyclic derivative and its salt which is displayed

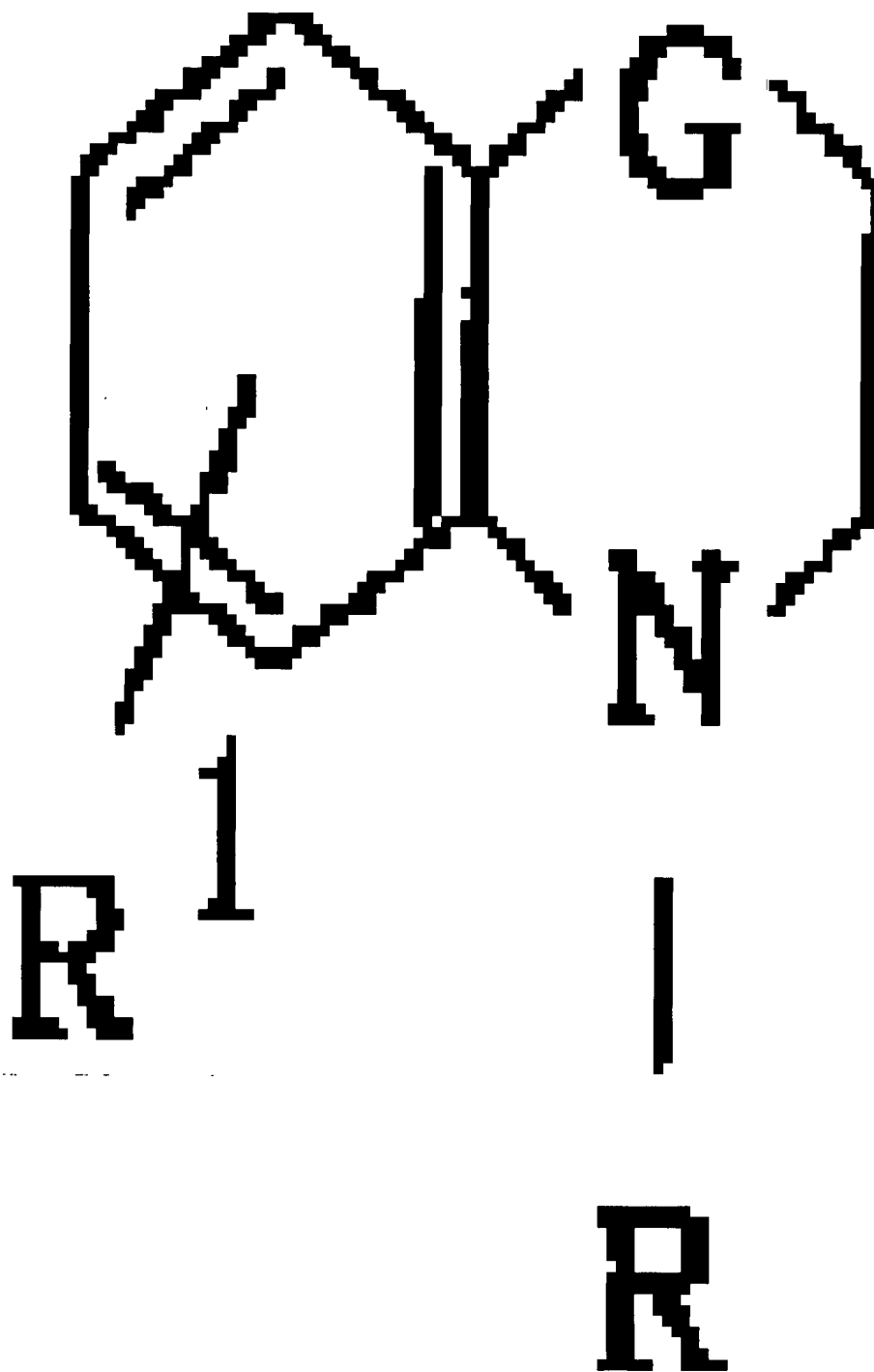
[Claim 3]

pharmaceutical composition . for oxytocin competition which contains at least 1 kind which is chosen from benzo heterocyclic derivative and its salt which is stated in Claim 2

[Claim 4]

General Formula

[Chemical Formula 15]

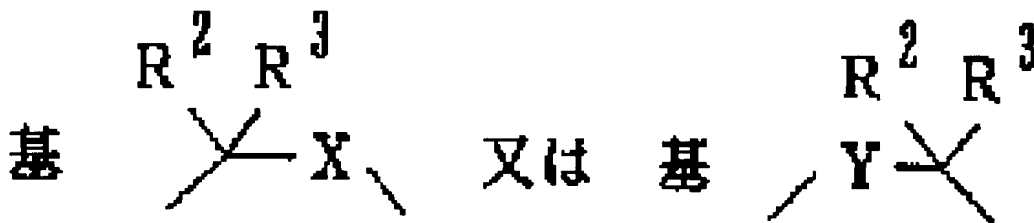


[式中 G は]

{As for G in Formula }

【化 16】

[Chemical Formula 16]



を示す。

R¹ は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。

R² は、基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は、同一又は異なつて、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。);水素原子;水酸基;低級アルコキシ基;カルボキシ置換低級アルキル基;シアノ置換低級アルキル基;テトラゾリル基置換低級アルキル基;低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基;低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基;低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基;カルボキシ基置換低級アルコキシ基;低級アルカノイル基;又は基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m及びuはそれぞれ0又は1を示す。但しm及びuは同時に0であつてはならない。Aは低級アルキレン基を示す。R⁶及びR⁷は同一又は異なつて、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R⁶及びR⁷は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5-7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換してい

It shows.

R¹ shows amino carbonyl lower alkoxy group which has fact that it possesses the lower alkyl group as amino group, carboxy substitution lower alkoxy group, lower alkoxy carbonyl substitution lower alkoxy group or substituent which has times when it possesses lower alkyl group as amino lower alkoxy group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and lower alkanoyl group as hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, substituent.

R² amino substitution lower alkanoyl oxy group; lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group; carboxyl substitution lower alkoxy group; lower alkanoyl group; or basis which has times when it possesses lower alkyl group basis -NR⁴R⁵ (R⁴ and R⁵ show benzoyl group which has fact that it possesses halogen atom as substituent on lower alkyl group or phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group as alike or different, hydrogen atom, substituent.); as hydrogen atom; hydroxy group; lower alkoxy group; carboxy substituted lower alkyl group; cyano substituted lower alkyl group; tetrazolyl group substituted lower alkyl group; lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group; lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group; substituent - shows (O) m-A-(CO) uNR⁶R⁷ (m and u show 0 or 1 respectively. However m or u with 0 do not become simultaneous. A shows lower alkylene group.

R⁶ and R⁷ show phenyl group which has fact that it possesses halogen atom on amino substituted lower alkyl group, carbamoyl group substituted lower alkyl group, adamantyl group substituted lower alkyl group, lower alkyl sulfonyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as alike or different, hydrogen atom, lower alkoxy group, lower alkyl group, substituent. R⁶ and R⁷ with nitrogen atom which these connect through the nitrogen atom or oxygen atom or 5 - 7 -member ring may form saturated heterocycle without minding. On said heterocycle,

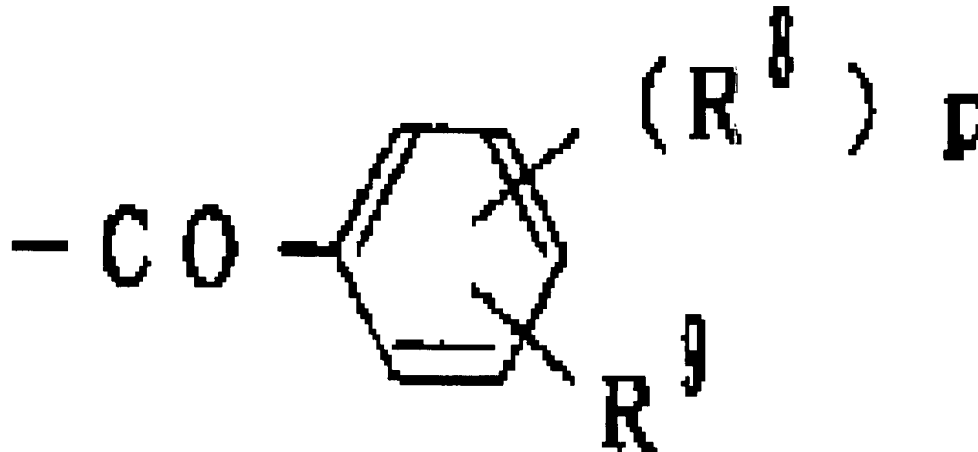
てもよい。)を示す。

R³ は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。

また R² と R³ とは、これらが一緒になってオキソ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。

R は、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレン基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基;シクロアルキルカルボニル基又は基

【化 17】



(p は 1 又は 2 を示す。R⁸ は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R⁹ は、基-NR¹⁰R¹¹(R¹⁰は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R¹¹は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アル

group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and phenyl lower alkyl group optionally substitutable .).

R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group .

In addition R² and R³, these becoming simultaneous, the oxo group , lower alkylidene group , lower alkoxy-substituted lower alkylidene group , lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group , or it is possible to form phenyl substitution lower alkylidene group .

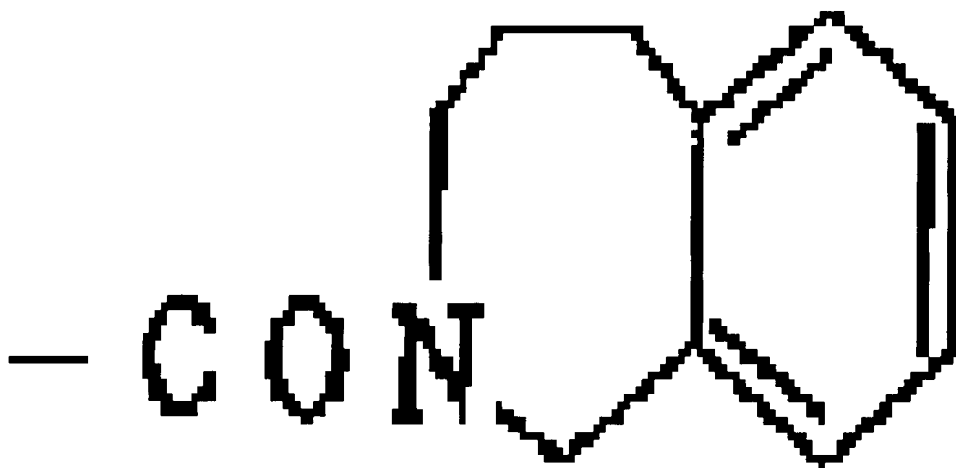
As for R, On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Which have times when it possesses phenyl group as substituent thegroup which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has times when itpossesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has timeswhen it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent thiazolyl carbonyl group ;cycloalkyl carbonyl group or basis

[Chemical Formula 17]

p shows 1 or 2 . R⁸ shows amino group , nitro group , halogen atom or lower alkoxy group which has times when itpossesses lower alkanoyl group as hydrogen atom , lower alkyl group , hydroxy group , substituent . As for R⁹, basis -NR¹⁰R¹¹(R¹⁰ shows lower alkanoyl group which has fact that it possesses the halogen atom hydrogen atom , lower alkyl group or as substituent . As for R¹¹ from group which becomes halogen atom and hydroxy group as

ルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基))

【化 18】



、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリ

lower alkyl group, substituent on lower alkanoyl group, cycloalkyl group, phenyl ring which has times when it possesses the group which is chosen there are times when it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and halogen atom as substituent, and On phenyl lower alkyl group, phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group in the lower alkyl group portion on phenoxy lower alkyl group, phenyl ring which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent as substituent there are times when it possesses group which is chosen from group which becomes amino group, nitro group, lower alkanoyl group substituted amino group and halogen atom which have times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group, phenyl group, lower alkoxy group, halogen atom substituted lower alkyl group, substituent, and In lower alkanoyl group portion lower alkoxy carbonyl group, lower alkoxy-substituted lower alkanoyl group, lower alkanoyl oxy substitution lower alkanoyl group, phenoxy lower alkoxy carbonyl group, benzo furil carbonyl group, benzoimidazolyl carbonyl group; quinolyl carbonyl group, quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, phenyl lower alkoxy carbonyl group, basis which has times when it possesses halogen atom as amino carbonyl group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group, pyridyl lower alkyl group and phenyl lower alkyl group as phenoxy lower alkanoyl group, substituent which has fact that it possesses halogen atom as substituent)

[Chemical Formula 18]

On tetrahydroisoquinolyl carbonyl group, benzoyl lower alkyl group, quinoline ring from group which becomes lower alkyl group and oxo group as substituent on tetrahydroquinolyloxy substitution lower alkanoyl group, lower alkyl

ルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルホルボニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。

またR¹⁰及びR¹¹は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。

);

水素原子;

低級アルカノイルオキシ基;

低級アルカノイル基;

低級アルコキシ基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基;

シクロアルキル基;

低級アルキル基;

低級アルキルチオ基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基;フェノキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を

sulfonyl group, pyridyl lower alkoxy carbonyl group, fluorenyl lower alkoxy carbonyl group, lower alkenyl oxycarbonyl group, tetrahydro naphthyl oxy substitution lower alkanoyl group, phenyl lower alkenyl carbonyl group, piperidine ring which has times when it possesses group which is chosen bipyridinyl lower alkoxy carbonyl group which has fact that it possesses group which is chosen is shown from group which becomes lower alkanoyl group, lower alkoxy carbonyl group and lower alkyl group as substituent.

In addition R¹⁰ and R¹¹ with nitrogen atom which these connect may form isoindoline ring.

);

hydrogen atom;

lower alkanoyl oxy group;

lower alkanoyl group;

lower alkoxy group;

On phenyl ring benzoyl group; which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

cycloalkyl group;

lower alkyl group;

lower alkyl thio group;

On phenyl ring phenyl lower alkanoyl group; which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

On phenyl ring as substituent amino group, phenyl group which has times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group, lower alkoxy group, phenyl lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, halogen atom substitution lower alkoxy group, nitro group, substituent and From group which becomes amino substitution lower alkoxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group; phenoxy group; phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on phenoxy lower alkyl group; phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on the phenyl lower alkyl group; phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent the times when it possesses lower alkyl group as substituent it is On anilino lower alkyl group; phenyl ring as halogen atom, lower alkoxy carbonyl group and substituent as substituent lower alkyl group and From group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent from group which becomes the amino carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen on phenyl lower alkoxy group; phenyl ring which has

有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基; フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基; ピロリジニル置換低級アルコキシ基; 窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1-4 個有する飽和もしくは不飽和の 5-11 員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基を 1-3 個有していてもよい); シクロアルケニル基; フェニル低級アルキルアミノカルボニル基; 置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基; シアノ基; 又は基-(A)m-CHR¹²R¹³(A は前記に同じ。R¹² は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。m は 0 又は 1 を示す。)を示す。

)X はメチレン基、単結合、基=CH-又は基-NR¹⁴-(R¹⁴ は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。

Y は-NR^A-を示す(R^A は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基-ACONR^BR^Cを示す。ここで R^B 及び R^C は、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこの R^B 及び R^C は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して 5-7 員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す。

]で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも 1 種を含有するベンゾレシン作働用医薬組成物。

Specification

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、ベンゾヘテロ環誘導体を含有する医

times when it possesses group which is chosen on benzoyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent on phenyl lower alkenyl group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent as substituent lower alkyl group it possesses amino sulfonyloxy group ;cyano group ; or basis which has times when it possesses lower alkyl group monocycle of 5 - 11 member rings of saturated or unsaturated which 1 - 4 possesses benzoyl lower alkyl group ;pyrrolidinyl substitution lower alkoxy group ;nitrogen atom , oxygen atom or sulfur atom which has thing or heterocyclic group of binary ring (As substituent becomes lower alkyl group , phenyl group , lower alkanoyl group , halogen atom , phenyl lower alkyl group and oxo group 1 - 3 it is possible to said heterocyclic group to have possessed group which is chosen from group which); as cycloalkenyl group ;phenyl lower alkyl amino carbonyl group ;substituent - (A) m-CHR¹²R¹³ (As for A same to description above. R¹² shows hydrogen atom , hydroxy group or lower alkanoyl oxy group . R¹³ on phenyl ring shows phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent . m shows 0 or 1 .) is shown.

) X methylene group , single bond , basis =CH- or basis -NR¹⁴- shows (R¹⁴ shows hydrogen atom , lower alkyl group or lower alkanoyl group .)

Y shows (hydrogen atom , lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group , carboxy substituted lower alkyl group or basis -ACONR^BR^C it shows R^A . R^B and R^C show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group here. In addition this R^B and R^C with nitrogen atom which these connect through nitrogen atom or oxygen atom or connecting mutually without minding, 5 - 7 -member ring may form saturated heterocycle . On said heterocycle lower alkyl group optionally substitutable .) which -NR^A- is shown.

) With pharmaceutical composition . for vasopressin work working which contains at least 1 kind which is chosen from benzo heterocyclic derivative and its salt which is displayed

[Description of the Invention]

[0001]

[Technological Field of Invention]

this invention regards pharmaceutical composition which

JP1997221476A

1997-8-26

薬組成物に関する。

【0517】

参考例 138

~参考例 141 で得られる化合物は、いずれも白色粉末状であった。

【0518】

適当な出発原料を用い、前記参考例 3、7、10 又は 12 と同様にして下記の化合物を得た。

【0519】

【表 44】

contains benzo heterocyclic derivative .

[0517]

Reference Example 138

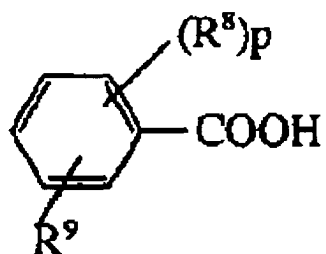
- compound which is acquired with Reference Example 141 in each case was the white powder .

[0518]

Below-mentioned compound was acquired making use of suitable starting material , to similar to aforementioned Reference Example 3, 7, 10 or 12.

[0519]

[Table 44]



参考例	R ⁸	p	R ⁹
142	H	1	
143	H	1	
144	H	1	

【0520】

参考例 142

及び参考例 143 で得られる化合物は、いずれも白色粉末状であり、参考例 144 で得られる化合物は淡褐色粉末状であった。

【0521】

適当な出発原料を用い、前記参考例 17 と同様

【0520】

Reference Example 142

And as for compound which is acquired with Reference Example 143, in each case with white powder, as for compound which is acquired with Reference Example 144 was a light brown powder.

【0521】

Below-mentioned compound was acquired making use of

にして下記の化合物を得た。

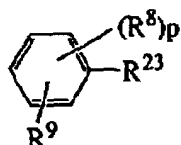
suitable starting material, to similar to aforementioned
Reference Example 17.

【0522】

【0522】

【表 45】

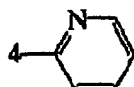
【Table 45】



参考例 145

構造

R^9 :



p : 1

R^8 : 2-CH₃

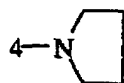
R^{23} : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

参考例 146

構造

R^9 :



p : 1

R^8 : 2-Cl

R^{23} : -COOCH₃

結晶形 : 黄色プリズム状
形態 : 遊離

【0523】

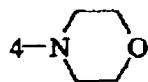
【0523】

【表 46】

[Table 46]

参考例 147

構造

R⁹ :

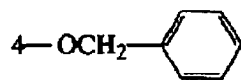
p : 1

R⁸ : 2-ClR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色針状
形態 : 遊離

参考例 148

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

参考例 149

構造

R⁹ : 4-OH

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 97 - 98.5℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0524】

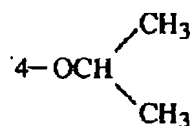
[0524]

【表 47】

[Table 47]

参考例 150

構造

R⁹ :

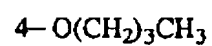
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

参考例 151

構造

R⁹ :

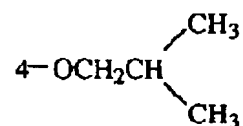
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

参考例 152

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

JP1997221476A

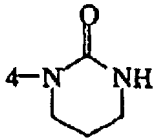
1997-8-26

【0525】

[0525]

【表 48】

[Table 48]

参考例 153	
構造	
R ⁹ :	4-NHCOCF ₃
p :	1
R ²³ :	-COOCH ₃
R ⁸ :	2-Cl
結晶形 :	白色粉末状
形態 :	遊離
参考例 154	
構造	
R ⁹ :	4-OCH ₂ CO ₂ H
p :	1
R ²³ :	-COOCH ₃
R ⁸ :	2-CH ₃
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	ジクロロメタン-n-ヘキサン
形態 :	遊離
参考例 155	
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ²³ :	-COOCH ₃
R ⁸ :	2-Cl
再結晶溶媒 :	黄色粉末状
再結晶溶媒 :	酢酸エチル-n-ヘキサン
融点 :	118 - 123℃
形態 :	遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0526】

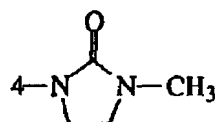
[0526]

【表 49】

[Table 49]

参考例 156

構造

R⁹ :

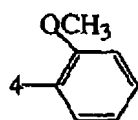
p : 1

R⁸ : 3-OCH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 157

構造

R⁹ :

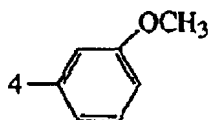
p : 1

R⁸ : 3-OCH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 158

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 3-OCH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

[0527]

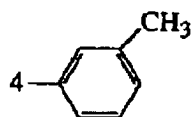
[0527]

[表 50]

[Table 50]

参考例 159

構造

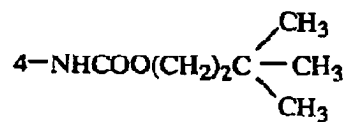
R⁹ :

p : 1

R⁸ : 3-OCH₃R²³ : -COOCH₃

参考例 160

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : -COOCH₃

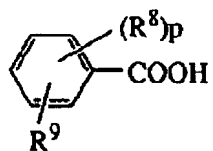
結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

[0528]

[0528]

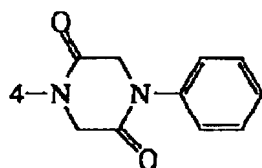
[表 51]

[Table 51]



参考例 161

構造

R⁹ :

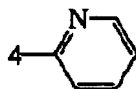
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 淡褐色粉末状
 再結晶溶媒 : クロロホルム—ジエチルエーテル
 形態 : 遊離

参考例 162

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : エタノール—ジエチルエーテル
 形態 : HCl

【0529】

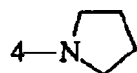
【0529】

【表 52】

【Table 52】

参考例 163

構造

R⁹ :

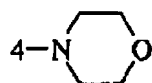
p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : HCl

参考例 164

構造

R⁹ :

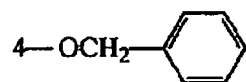
p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 165

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン
融点 : 127.5 - 130℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0530】

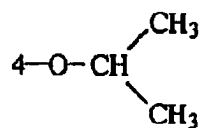
[0530]

【表 53】

[Table 53]

参考例 166

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 167

構造

R⁹ :

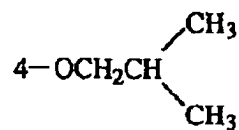
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 168

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状
形態 : 遊離

【0531】

[0531]

JP1997221476A

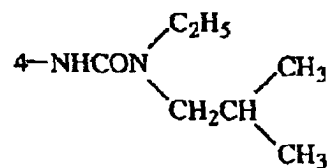
1997-8-26

【表 54】

[Table 54]

参考例 169

構造

R⁹ :

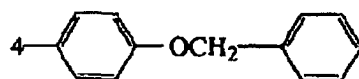
p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 170

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 171

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-Cl

再結晶溶媒 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0532】

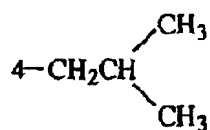
{0532}

【表 55】

[Table 55]

参考例 172

構造

R⁹ :

p : 1

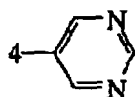
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 173

構造

R⁹ :

p : 1

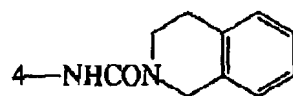
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

参考例 174

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0533】

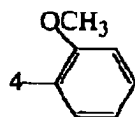
[0533]

【表 56】

[Table 56]

参考例 175

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

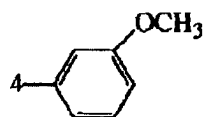
結晶形 : 白色粉末状

融点 : 170 - 171℃

形態 : 遊離

参考例 176

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

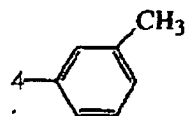
結晶形 : 白色粉末状

融点 : 128 - 129℃

形態 : 遊離

参考例 177

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 146 - 147℃

形態 : 遊離

【0534】

【0534】

【表 57】

[Table 57]

参考例	178
構造	
R ⁹ :	$4\text{-NHCOO}(\text{CH}_2)_2\text{C} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array}$
p :	1
R ⁸ :	2-OCH ₃
結晶形	白色粉末状
形態	遊離

【0535】

上記で得られる各参考例化合物の NMR スペクトルは、次の通りである。

【0536】

参考例 18

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.90-3.06[全 9 H,m,2.38(s)],3.30-3.72(4H,m), 3.85(3H,s), 6.35-6.81[全 2H,m,6.53(dd,J=8.93Hz,J=8.99Hz), 6.67(d,J=2.32Hz)],7.83(1H,d,J=8.95Hz)。

【0537】

参考例 19

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.92-3.60(全 8 H,m), 3.88(3H,s), 6.79-7.48 及び 7.78-7.79[全 8 H,m,6.79(dd,J=8.92Hz,J=8.92Hz)]。

【0538】

参考例 20

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.68-2.09[全 4 H,m,1.77(d,J=3.30Hz), 1.84(d,J=4.20Hz)],2.61-3.12(全 3H,m), 3.75-4.10[全 5H,m,3.87(s)],6.78(1H,dd,J=8.96Hz,J=8.97Hz), 6.92(1H,d,J=2.58Hz), 7.15-7.41(全 5H,m), 7.86(1H,d,J=8.92Hz)。

【0535】

nmr spectrum of each Reference Example compound which is acquired with description above seems following way.

【0536】

Reference Example 18

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.90-3.06 {All 9 H, m, 2.38 (s) }, 3.30 - 3.72 (4 H, m), 3.85 (3 H, s), 6.35 - 6.81 {All 2 H, m, 6.53 (dd, J=8.93Hz, J=8.99Hz), 6.67 (d, J=2.32Hz) }, 7.83 (1 H, d, J=8.95Hz).

【0537】

Reference Example 19

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.92-3.60 (All 8 H, m), 3.88 (3 H, s), 6.79 - 7.48 and 7.78 - 7.79 {All 8 H, m, 6.79 (dd, J=8.92Hz, J=8.92Hz) }.

【0538】

Reference Example 20

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.68-2.09 {All 4 H, m, 1.77 (d, J=3.30Hz), 1.84 (d, J=4.20Hz) }, 2.61 - 3.12 (All 3 H, m), 3.75 - 4.10 {All 5 H, m, 3.87 (s) }, 6.78 (1 H, dd, J=8.96Hz, J=8.97Hz), 6.92 (1 H, d, J=2.58Hz), 7.15 - 7.41 (All 5 H, m), 7.86 (1 H, d,

z), 7.15-7.41(全 5H,m), 7.86(1H,d,J=8.92Hz)。

【0539】

参考例 21

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.57(3H,t,J=5.21Hz), 3.31(3H,t,J=5.23Hz), 3.55(2H,s), 3.86(3H,s), 6.72(1H,dd,J=8.95Hz,J=8.94Hz), 6.85(1H,d,J=2.56Hz), 7.19-7.49(5H,m), 7.82(1H,d,J=8.91Hz)。

【0540】

参考例 22

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.66(3H,s), 3.85(3H,s), 3.89(3H,s), 6.81-7.60(6H,m), 7.85-8.08(1H,m)。

【0541】

参考例 23

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.94(3H,s), 7.39-7.70(5H,m), 7.79-7.92(2H,m), 8.02-8.11(1H,m)。

【0542】

参考例 24

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:3.4-3.55(2H,m), 3.8(3H,s), 3.8-3.95(2H,m), 7.36(1H,s), 7.50(1H,dd,J=8.8Hz,J=2Hz), 7.82(1H,d,J=8.8Hz), 7.86(1H,d,J=2Hz)。

【0543】

参考例 25

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.67(3H,s), 3.93(3H,s), 7.22-7.43(3H,m), 7.95-8.08(1H,m), 8.48-8.63(1H,m), 8.65-8.75(1H,m)。

【0544】

参考例 26

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.69(3H,s), 3.93(3H,s), 7.41-7.63(4H,m), 7.95-8.08(1H,m), 8.62-8.76(2H,m)。

J=8.92Hz)。

【0539】

Reference Example 21

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.57 (3 H, t, J=5.21Hz), 3.31 (3 H, t, J=5.23Hz), 3.55 (2 H, s), 3.86 (3 H, s), 6.72 (1 H, dd, J=8.95Hz, J=8.94Hz), 6.85 (1 H, d, J=2.56Hz), 7.19 - 7.49 (5 H, m), 7.82 (1 H, d, J=8.91Hz)。

【0540】

Reference Example 22

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.66 (3 H, s), 3.85 (3 H, s), 3.89 (3 H, s), 6.81 - 7.60 (6 H, m), 7.85 - 8.08(1 H, m)。

【0541】

Reference Example 23

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :3.94 (3 H, s), 7.39 - 7.70 (5 H, m), 7.79 - 7.92 (2 H, m), 8.02 - 8.11 (1 H, m)。

【0542】

Reference Example 24

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm :3.4- 3.55 (2 H, m), 3.8 (3 H, s), 3.8 - 3.95 (2 H, m), 7.36 (1 H, s), 7.50 (1 H, dd, J=8.8Hz, J=2Hz), 7.82(1 H, d, J=8.8Hz), 7.86 (1 H, d, J=2Hz)。

【0543】

Reference Example 25

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.67 (3 H, s), 3.93 (3 H, s), 7.22 - 7.43 (3 H, m), 7.95 - 8.08 (1 H, m), 8.48 -8.63 (1 H, m), 8.65 - 8.75 (1 H, m)。

【0544】

Reference Example 26

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.69 (3 H, s), 3.93 (3 H, s), 7.41 - 7.63 (4 H, m), 7.95 - 8.08 (1 H, m), 8.62 -8.76 (2 H, m)。

[0545]

参考例 30

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.88(3H,t,J=7.4Hz), 1.05(3H,t,J=7.4Hz), 1.80(3H,hept,J=7.4Hz), 4.00(2H,t,J=7.4Hz), 4.31(3H,t,J=7.4Hz), 7.06(1H,d,J=1.1Hz), 7.17(1H,d,J=1.1Hz), 7.60-7.76(2H,m), 8.06-8.22(2H,m)。

[0546]

参考例 31

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.68(3H,s), 7.20-7.36(1H,m), 7.40-7.66(4H,m), 7.66-7.90(2H,m), 8.58-8.74(1H,m)。

[0547]

参考例 32

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.96(3H,s), 7.22-7.35(1H,m), 7.56(1H,t,J=7.8Hz), 7.72-7.86(2H,m), 8.09(1H,dt,J=1.5Hz,J=7.8Hz), 8.24(1H,dd,J=1.2Hz,J=1.8Hz,J=7.8Hz), 8.65(1H,t,J=1.6Hz), 8.69-8.77(1H,m)。

[0548]

参考例 33

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:3.96(3H,s), 7.39(1H,ddd,J=0.8Hz,J=4.8Hz,J=7.8Hz), 7.57(1H,t,J=7.8Hz), 7.75-7.83(1H,m), 7.87-7.97(1H,m), 8.08(1H,dt,J=1.3Hz,J=7.8Hz), 8.27(1H,t,J=1.6Hz), 8.63(1H,dd,J=1.6Hz,J=4.8Hz), 8.88(1H,dd,J=0.7Hz,J=2.4Hz)。

[0549]

参考例 34

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:2.69(3H,s), 3.92(3H,s), 7.32-7.53(3H,m), 7.89(1H,ddd,J=1.7Hz,J=2.3Hz,J=7.1Hz), 8.03(1H,d,J=8.6Hz), 8.63(1H,dd,J=1.6Hz,J=4.8Hz), 8.86(1H,dd,J=0.7Hz,J=1.6Hz)。

[0550]

参考例 35

[0545]

Reference Example 30

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.88 (3 H, t, J=7.4Hz), 1.05 (3 H, t, J=7.4Hz), 1.80 (3 H, hept, J=7.4Hz), 4.00 (2 H, t, J=7.4Hz), 4.31 (3 H, t, J=7.4Hz), 7.06 (1 H, d, J=1.1Hz), 7.17 (1 H, d, J=1.1Hz), 7.60 - 7.76 (2 H, m), 8.06 - 8.22 (2 H, m) .

[0546]

Reference Example 31

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :3.68 (3 H, s), 7.20 - 7.36 (1 H, m), 7.40 - 7.66 (4 H, m), 7.66 - 7.90 (2 H, m), 8.58 - 8.74 (1 H, m) .

[0547]

Reference Example 32

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :3.96 (3 H, s), 7.22 - 7.35 (1 H, m), 7.56 (1 H, t, J=7.8Hz), 7.72 - 7.86 (2 H, m), 8.09(1 H, dt, J=1.5Hz , J=7.8Hz), 8.24 (1 H, ddd, J=1.2Hz , J=1.8Hz , J=7.8Hz), 8.65 (1 H, t, J=1.6Hz), 8.69 - 8.77 (1 H, m) .

[0548]

Reference Example 33

compound

¹H-nmr (250 MHz , CDCl₃);de ppm :3.96 (3 H, s), 7.39 (1 H, ddd, J=0.8Hz , J=4.8Hz , J=7.8Hz), 7.57 (1 H, t, J=7.8Hz), 7.75 - 7.83 (1 H, m), 7.87 - 7.97(1 H, m), 8.08 (1 H, dt, J=1.3Hz , J=7.8Hz), 8.27 (1 H, t, J=1.6Hz), 8.63 (1 H, dd, J=1.6Hz , J=4.8Hz), 8.88 (1 H, dd, J=0.7Hz , J=2.4Hz) .

[0549]

Reference Example 34

compound

¹H-nmr (250 MHz , CDCl₃);de ppm :2.69 (3 H, s), 3.92 (3 H, s), 7.32 - 7.53 (3 H, m), 7.89 (1 H, ddd, J=1.7Hz , J=2.3Hz , J=7.1Hz), 8.03 (1 H, d, J=8.6Hz), 8.63(1 H, dd, J=1.6Hz , J=4.8Hz), 8.86 (1 H, dd, J=0.7Hz , J=1.6Hz) .

[0550]

Reference Example 35

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:3.95(3H,s), 7.32-7.56(4H,m), 7.59-7.66(2H,m), 7.75-7.83(1H,m), 7.99-8.07(1H,m), 8.25-8.33(1H,m)。

【0551】

参考例 36

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.27(3H,s), 3.91(3H,s), 3.92(3H,s), 6.86-7.04(2H,m), 7.16-7.41(4H,m), 7.76-7.96(1H,m)。

【0552】

参考例 37

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.81,3.90 及び 3.93(各 3H,各 s), 6.87-7.23(4H,m), 7.29-7.52(2H,m), 7.76-7.92(1H,m)。

【0553】

参考例 38

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.91 及び 3.97 (各 3H,各 s), 7.11-7.28(2H,m), 7.32-7.55(3H,m), 7.56-7.70(2H,m), 7.89(1H,d,J=8.0Hz)。

【0554】

参考例 39

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.39(3H,s), 3.79(6H,s), 3.95(3H,s), 7.23(4H,s), 7.33(2H,s)。

【0555】

参考例 40

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.87 及び 3.94 (各 3H,各 s), 7.21-7.50(4H,m), 7.51-7.61(2H,m), 7.62-7.83(2H,m)。

【0556】

参考例 41

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.43 及び 3.94

compound

¹H-nmr (250 MHz , CDCl₃);de ppm :3.95 (3 H, s), 7.32 - 7.56 (4 H, m), 7.59 - 7.66 (2 H, m), 7.75 - 7.83 (1 H, m),7.99 - 8.07 (1 H, m), 8.25 - 8.33 (1 H, m) .

【0551】

Reference Example 36

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.27 (3 H, s), 3.91 (3 H, s), 3.92 (3 H, s), 6.86 - 7.04 (2 H, m), 7.16 - 7.41(4 H, m), 7.76 - 7.96 (1 H, m) .

【0552】

Reference Example 37

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :3.81, 3.90 and 3.93 (Each 3 H, each s), 6.87 - 7.23 (4 H, m), 7.29 - 7.52 (2 H, m), 7.76 - 7.92 (1 H, m) .

【0553】

Reference Example 38

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :3.91 and 3.97 (Each 3 H, each s), 7.11 - 7.28 (2 H, m), 7.32 - 7.55 (3 H, m), 7.56 - 7.70 (2 H, m), 7.89 (1 H, d, J=8.0Hz) .

【0554】

Reference Example 39

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.39 (3 H, s), 3.79 (6 H, s), 3.95 (3 H, s), 7.23 (4 H, s), 7.33 (2 H, s) .

【0555】

Reference Example 40

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :3.87 and 3.94 (Each 3 H, each s), 7.21 - 7.50 (4 H, m), 7.51 - 7.61 (2 H, m), 7.62 - 7.83 (2 H, m) .

【0556】

Reference Example 41

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de

(各 3H,各 s), 7.08-7.29(1H,m), 7.30-7.50(3H,m), 7.58-7.72(2H,m), 8.02-8.18(2H,m)。

【0557】

参考例 42

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.24,2.37,3.90 及び 3.91(各 3H,各 s), 6.78-6.98(2H,m), 7.00-7.19(3H,m), 7.73-7.90(1H,m)。

【0558】

参考例 43

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.42(3H,t,J=7.1Hz), 4.41(2H,q,J=7.1Hz), 7.27-7.90 及び 8.02-8.22(全 13H,m)。

【0559】

参考例 44

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.37(3H,t,J=7.1Hz), 4.34(2H,q,J=7.1Hz), 7.01-7.31 及び 7.32-7.68(全 11H,m), 7.79-8.00(2H,m)。

【0560】

参考例 45

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.47(3H,t,J=7Hz), 4.41(2H,q,J=7Hz), 7.29-7.57,7.58-7.84 及び 8.03-8.21(全 13H,m)。

【0561】

参考例 46

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.42(3H,s), 2.67(3H,s), 3.91(3H,s), 7.07-7.59(6H,m), 7.87-8.11(1H,m)。

【0562】

参考例 47

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.91,3.94,3.97 及び 3.98(各 3H,各 s), 6.96(1H,d,J=8.3Hz), 7.03-7.24(4H,m), 7.88(1H,d,J=7.9Hz)。

【0563】

ppm :2.43 and 3.94 (Each 3 H, each s), 7.08 - 7.29 (1 H, m), 7.30 - 7.50 (3 H, m), 7.58 - 7.72 (2 H, m), 8.02 - 8.18 (2 H, m) .

【0557】

Reference Example 42

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.24, 2.37, 3.90 and 3.91 (Each 3 H, each s), 6.78 - 6.98 (2 H, m), 7.00 - 7.19 (3 H, m), 7.73 - 7.90 (1 H, m) .

【0558】

Reference Example 43

compound

¹H-nmr (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.42 (3 H, t, J=7.1Hz), 4.41 (2 H, q, J=7.1Hz), 7.27 - 7.90 and 8.02 - 8.22 (All 13 H, m) .

【0559】

Reference Example 44

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.37 (3 H, t, J=7.1Hz), 4.34 (2 H, q, J=7.1Hz), 7.01 - 7.31 and 7.32 - 7.68 (All 11 H, m), 7.79 - 8.00 (2 H, m) .

【0560】

Reference Example 45

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.47 (3 H, t, J=7Hz), 4.41 (2 H, q, J=7Hz), 7.29 - 7.57 and 7.58 - 7.84 and 8.03 - 8.21 (All 13 H, m) .

【0561】

Reference Example 46

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.42 (3 H, s), 2.67 (3 H, s), 3.91 (3 H, s), 7.07 - 7.59 (6 H, m), 7.87 - 8.11(1 H, m) .

【0562】

Reference Example 47

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :3.91, 3.94, 3.97 and 3.98 (Each 3 H, each s), 6.96 (1 H, d, J=8.3Hz), 7.03 - 7.24 (4 H, m), 7.88 (1 H, d, J=7.9Hz) .

【0563】

参考例 48

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.43,3.91 及び 3.98(各 3H,各 s), 7.04-7.29(3H,m), 7.30-7.51(3 H,m), 7.88(1H,d,J=7.9Hz)。

【0564】

参考例 49

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.67(3H,s), 3.86(3H,s), 3.90(3H,s), 6.90-7.08(2H,m), 7.35-7.49(2H,m)及び 7.50-7.66(2H,m), 7.89-8.07(1H, m)。

【0565】

参考例 50

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.69(3H,s), 3.92(3H,s), 7.27-7.81 及び 7.95-8.11(全 12H,m)。

【0566】

参考例 51

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.12(3H,s), 3.82(3H,s), 3.95(3H,s), 7.02-7.48(5H,m), 7.63(1 H,d,J=1.4Hz), 7.71(1H,dd,J=7.7Hz,J=1.4Hz)。

【0567】

参考例 52

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.05(3H,s), 3.77(6H,s), 3.96(3H,s), 7.03-7.18(1H,m), 7.19-7.32(3H,m), 7.34(2H,s)。

【0568】

参考例 53

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.40,3.90 及び 3.97(各 3H,各 s), 7.09-7.34(4H,m), 7.42-7.59(2 H,m), 7.87(1H,d,J=7.9Hz)。

【0569】

参考例 54

の化合物

Reference Example 48

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.43, 3.91 and 3.98 (Each 3 H, each s), 7.04 - 7.29 (3 H, m), 7.30 - 7.51 (3 H, m), 7.88(1 H, d, J=7.9Hz).

【0564】

Reference Example 49

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.67 (3 H, s), 3.86 (3 H, s), 3.90 (3 H, s), 6.90 - 7.08 (2 H, m), 7.35 - 7.49(2 H, m) and 7.50 - 7.66 (2 H, m), 7.89 - 8.07 (1 H, m).

【0565】

Reference Example 50

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.69 (3 H, s), 3.92 (3 H, s), 7.27 - 7.81 and 7.95 - 8.11 (All 12 H, m).

【0566】

Reference Example 51

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.12 (3 H, s), 3.82 (3 H, s), 3.95 (3 H, s), 7.02 - 7.48 (5 H, m), 7.63 (1 H, d, J=1.4Hz), 7.71(1 H, dd, J=7.7Hz, J=1.4Hz).

【0567】

Reference Example 52

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.05 (3 H, s), 3.77 (6 H, s), 3.96 (3 H, s), 7.03 - 7.18 (1 H, m), 7.19 - 7.32(3 H, m), 7.34 (2 H, s).

【0568】

Reference Example 53

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.40, 3.90 and 3.97 (Each 3 H, each s), 7.09 - 7.34 (4 H, m), 7.42 - 7.59 (2 H, m), 7.87(1 H, d, J=7.9Hz).

【0569】

Reference Example 54

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.26,2.65 及び 3.91(各 3H,各 s), 7.08-7.38(6H,m), 7.89-8.02(1 H,m)。

【0570】

参考例 55

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.41 及び 3.93 (各 3H,各 s), 7.17-7.34(2H,m), 7.46-7.57(2H, m), 7.58-7.72(2H,m), 8.02-8.16(2H,m)。

【0571】

参考例 56

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.26 及び 3.94 (各 3H,各 s), 7.14-7.35(4H,m), 7.36-7.52(2H, m), 7.99-8.18(2H,m)。

【0572】

参考例 57

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.68(3H,s), 3.91(3H,s), 7.29-7.54 及び 7.55-7.72(全 7H,m), 7.91-8.08(1H,m)。

【0573】

参考例 58

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.04(6H,s), 3.88 及び 3.92(各 3H,各 s), 6.71-6.85(2H,m), 7.06 -7.48(3H,m), 7.78-7.93(1H,m)。

【0574】

参考例 59

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.66(3H,s), 3.90(3H,s), 5.12(2H,s), 6.98-7.12(2H,m), 7.20-7.68(10H,m)。

【0575】

参考例 60

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.70(3H,s), 3.93(3H,s), 7.38-7.58(2H,m), 7.68-7.87(2H,m), 7.98-8.12(1H,m), 8.21-8.46(2H,m)。

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.26, 2.65 and 3.91 (Each 3 H, each s), 7.08 - 7.38 (6 H, m), 7.89 - 8.02 (1 H, m).

【0570】

Reference Example 55

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.41 and 3.93 (Each 3 H, each s), 7.17 - 7.34 (2 H, m), 7.46 - 7.57 (2 H, m), 7.58 - 7.72 (2 H, m), 8.02 - 8.16 (2 H, m).

【0571】

Reference Example 56

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.26 and 3.94 (Each 3 H, each s), 7.14 - 7.35 (4 H, m), 7.36 - 7.52 (2 H, m), 7.99 - 8.18 (2 H, m).

【0572】

Reference Example 57

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.68 (3 H, s), 3.91 (3 H, s), 7.29 - 7.54 and 7.55 - 7.72 (All 7 H, m), 7.91 - 8.08 (1 H, m).

【0573】

Reference Example 58

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.04 (6 H, s), 3.88 and 3.92 (Each 3 H, each s), 6.71 - 6.85 (2 H, m), 7.06 - 7.48(3 H, m), 7.78 - 7.93 (1 H, m).

【0574】

Reference Example 59

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.66 (3 H, s), 3.90 (3 H, s), 5.12 (2 H, s), 6.98 - 7.12 (2 H, m), 7.20 - 7.68(10 H, m).

【0575】

Reference Example 60

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.70 (3 H, s), 3.93 (3 H, s), 7.38 - 7.58 (2 H, m), 7.68 - 7.87 (2 H, m), 7.98 - 8.12 (1 H, m), 8.21 - 8.46 (2 H, m).

【0576】

参考例 61

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.42(3H,t,J=7.0Hz), 4.42(2H,q,J=7.0Hz), 7.28-7.78 及び 7.85-8.18(全 8H,m)。

【0577】

参考例 62

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.40(3H,s), 2.67(3H,s), 3.90(3H,s), 7.18-7.31(2H,m), 7.37-7.58(4H,m), 7.91-8.05(1H,m)。

【0578】

参考例 63

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.44(3H,t,J=7.0Hz), 2.66(3H,s), 3.90(3H,s), 4.10(2H,q,J=7.0Hz), 6.88-7.06(2H,m), 7.34-7.49(2H,m), 7.50-7.64(2H,m), 7.89-8.06(1H,m)。

【0579】

参考例 64

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.06(3H,t,J=7.4Hz), 1.70-1.97(2H,m), 2.66(3H,s), 3.90(3H,s), 3.97(2H,d,J=6.5Hz), 6.89-7.08(2H,m), 7.35-7.48(2H,m), 7.49-7.64(2H,m), 7.89-8.08(1H,m)。

【0580】

参考例 65

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.40-2.90 及び 3.21-3.90[全 13H,m,2.33(s)],6.50-8.40[全 4H,m,7.71(d,J=8.41Hz)]。

【0581】

参考例 66

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.85-4.90(全 9 H,m), 6.79-7.38 及び 7.45-7.69(全 7H,m)。

【0576】

Reference Example 61

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.42 (3 H, t, J=7.0Hz), 4.42 (2 H, q, J=7.0Hz), 7.28 - 7.78 and 7.85 - 8.18 (All 8 H, m).

【0577】

Reference Example 62

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.40 (3 H, s), 2.67 (3 H, s), 3.90 (3 H, s), 7.18 - 7.31 (2 H, m), 7.37 - 7.58(4 H, m), 7.91 - 8.05 (1 H, m).

【0578】

Reference Example 63

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.44 (3 H, t, J=7.0Hz), 2.66 (3 H, s), 3.90 (3 H, s), 4.10 (2 H, q, J=7.0Hz), 6.88 - 7.06 (2 H, m), 7.34- 7.49 (2 H, m), 7.50 - 7.64 (2 H, m), 7.89 - 8.06 (1 H, m).

【0579】

Reference Example 64

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.06 (3 H, t, J=7.4Hz), 1.70 - 1.97 (2 H, m), 2.66 (3 H, s), 3.90 (3 H, s), 3.97 (2 H, d, J=6.5Hz), 6.89- 7.08 (2 H, m), 7.35 - 7.48 (2 H, m), 7.49 - 7.64 (2 H, m), 7.89 - 8.08 (1 H, m).

【0580】

Reference Example 65

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO -d₆); de ppm :1.40-2.90 and 3.21 - 3.90 {All 13 H, m, 2.33 (s) }, 6.50 - 8.40 {All 4 H, m, 7.71 (d, J=8.41Hz) }.

【0581】

Reference Example 66

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.85-4.90 (All 9 H, m), 6.79 - 7.38 and 7.45 - 7.69 (All 7 H, m).

【0582】

参考例 68

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.60-4.75 (全 11H,m), 6.80-7.85[全 8H,m,7.77(d,J=8.80Hz)]。

【0583】

参考例 70

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.74(3H,s), 3.88(3H,s), 5.82-8.39[全 8H,m,6.95(d,J=8.0Hz), 8.15(d,J=8.52Hz)]。

【0584】

参考例 75

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.77(3H,s), 3.42-3.50(2H,m), 3.78-3.86(2H,m), 7.49(1H,d,J=8.8Hz,J=2.2Hz), 7.83(1H,d,J=8.8Hz), 7.84(1H,d,J=2.2Hz), 12.6-13.3(1H,m)。

【0585】

参考例 76

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.86(6H,d,J=6.6Hz), 1.8-2.05(1H,m), 3.0(2H,d,J=7.2Hz), 3.4-3.55(2H,m), 3.8-3.95(2H,m), 7.49(1H,dd,J=8.8Hz,J=2.2Hz), 7.83(1H,d,J=8.8Hz), 7.85(1H,d,J=2.2Hz), 12.8-13.1(1H,m)。

【0587】

参考例 78

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.93(3H,s), 4.56(2H,s), 7.20-7.50(5H,m), 7.62(2H,d,J=8.7Hz), 7.81(2H,d,J=8.7Hz), 8.76(1H,s)。

【0588】

参考例 79

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:7.38-7.51(1H,m), 7.51-7.95(4H,m), 7.95-8.10(1H,m), 8.68-7.95(2H,m), 10.3-13.5(1H,br)。

【0582】

Reference Example 68

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆); de ppm :2.60-4.75 (All 11 H, m), 6.80 - 7.85 {All 8 H, m, 7.77 (d, J=8.80Hz) }.

【0583】

Reference Example 70

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); de ppm :2.74 (3 H, s), 3.88 (3 H, s), 5.82 - 8.39 {All 8 H, m, 6.95 (d, J=8.0Hz), 8.15 (d, J=8.52Hz) }.

【0584】

Reference Example 75

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆); de ppm :2.77 (3 H, s), 3.42 - 3.50 (2 H, m), 3.78 - 3.86 (2 H, m), 7.49 (1 H, dd, J=8.8Hz , J=2.2Hz), 7.83(1 H, d, J=8.8Hz), 7.84 (1 H, d, J=2.2Hz), 12.6 - 13.3 (1 H, m).

【0585】

Reference Example 76

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆); de ppm :0.86 (6 H, d, J=6.6Hz), 1.8 - 2.05 (1 H, m), 3.0 (2 H, d, J=7.2Hz), 3.4 - 3.55 (2 H, m), 3.8 - 3.95 (2 H, m), 7.49 (1 H, dd, J=8.8Hz , J=2.2Hz), 7.83 (1 H, d, J=8.8Hz), 7.85 (1 H, d, J=2.2Hz), 12.8 - 13.1 (1 H, m).

【0587】

Reference Example 78

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆); de ppm :2.93 (3 H, s), 4.56 (2 H, s), 7.20 - 7.50 (5 H, m), 7.62 (2 H, d, J=8.7Hz), 7.81 (2 H, d, J=8.7Hz), 8.76(1 H, s).

【0588】

Reference Example 79

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆); de ppm :7.38-7.51 (1 H, m), 7.51 - 7.95 (4 H, m), 7.95 - 8.10 (1 H, m), 8.68 - 7.95 (2 H, m), 10.3 - 13.5 (1 H, br).

【0589】

参考例 80

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.58(3H,s), 7.38-7.48(2H,m), 7.48-7.64(1H,m), 7.46-8.01 (1H,m), 8.63(1H,d,J=5.0Hz), 8.80(1H,s)。

【0590】

参考例 81

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.22(3H,s), 2.30-2.58(4H,m), 3.15-3.40(4H,m), 6.85-7.05 (2H,m), 7.15-7.84(2H,m), 11.75-12.80(1H,br s)。

【0591】

参考例 94

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.77(3H,t,J=7.3Hz), 1.75(2H,q,J=7.3Hz), 4.15(2H,t,J=7.3Hz), 7.31-7.97(3H,m), 8.02(1H,d,J=1.7Hz), 8.11-8.27(2H,m)。

【0592】

参考例 95

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:7.19(1H,s), 7.35-7.64(2H,m), 7.69(1H,s), 8.00-8.30(4H,m), 10.40-11.62(1H,brs)。

【0593】

参考例 98

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.55-1.94(4H,m), 2.13-2.30(2H,m), 2.31-2.56(2H,m), 2.66(3H,s), 6.18-6.35(1H,m), 7.15-7.42(2H,m), 7.90-8.18(1H,m)。

【0594】

参考例 99

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.62(3H,s), 7.58-7.82(2H,m), 7.88-8.19(3H,m), 8.21-8.48

(1 H, br)。

【0589】

Reference Example 80

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :2.58 (3 H, s), 7.38 - 7.48 (2 H, m), 7.48 - 7.64 (1 H, m), 7.46 - 8.01 (1 H, m),8.63 (1 H, d, J=5.0Hz), 8.80 (1 H, s)。

【0590】

Reference Example 81

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :2.22 (3 H, s), 2.30 - 2.58 (4 H, m), 3.15 - 3.40 (4 H, m), 6.85 - 7.05 (2 H, m),7.15 - 7.84 (2 H, m), 11.75 - 12.80 (1 H, brs)。

【0591】

Reference Example 94

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.77 (3 H, t, J=7.3Hz), 1.75 (2 H, q, J=7.3Hz), 4.15 (2 H, t, J=7.3Hz), 7.31 - 7.97 (3 H, m), 8.02 (1 H, d, J=1.7Hz), 8.11- 8.27 (2 H, m)。

【0592】

Reference Example 95

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :7.19 (1 H, s), 7.35 - 7.64 (2 H, m), 7.69 (1 H, s), 8.00 - 8.30 (4 H, m), 10.40- 11.62 (1 H, brs)。

【0593】

Reference Example 98

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.55-1.94 (4 H, m), 2.13 - 2.30 (2 H, m), 2.31 - 2.56 (2 H, m), 2.66 (3 H, s), 6.18 -6.35 (1 H, m), 7.15 - 7.42 (2 H, m), 7.90 - 8.18 (1 H, m)。

【0594】

Reference Example 99

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :2.62 (3 H, s), 7.58 - 7.82 (2 H,

(2H,m), 12.97(1H,s)。

【0595】

参考例 102

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.42-2.00(6H, m), 2.18-2.46(2H,m), 2.47-2.79(2H,m), 2.66(3 H,s), 6.21(1H,t,J=6.7Hz), 7.05-7.40(1H,m), 7.8-8.12(1H,m)。

【0596】

参考例 111

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:7.03-7.31(7H, m), 7.32-7.58(4H,m), 7.95(2H,d,J=8.35Hz)。

【0597】

参考例 113

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.30 及び 4.15 (各 3H,各 s), 7.09-7.48(6H,m), 8.23(1H,d,J=8.1 Hz), 10.00-11.42(1H,m)。

【0598】

参考例 114

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.73 及び 3.87 (各 3H,各 s), 7.00 及び 7.59(各 2H,各 dd,J=8.8Hz, J=2.1Hz), 7.36-7.52(2H,m), 8.03-8.21(1H, m)。

【0599】

参考例 116

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.14 及び 3.85 (各 3H,各 s), 7.09-7.41(5H,m), 7.71(1H,d,J=1.4 Hz), 7.82(1H,dd,J=8.0Hz,J=1.5Hz)。

【0600】

参考例 120

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.21-2.06 及び 2.48-2.82(全 13H,m), 2.63(3H,s), 4.84-6.49(1H, m), 6.98-7.19(2H,m), 7.99(1H,d,J=8.7Hz)。

m), 7.88 - 8.19 (3 H, m), 8.21 - 8.48 (2 H, m), 12.97 (1 H, s)。

【0595】

Reference Example 102

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.42-2.00 (6 H, m), 2.18 - 2.46 (2 H, m), 2.47 - 2.79 (2 H, m), 2.66 (3 H, s), 6.21(1 H, t, J=6.7Hz), 7.05 - 7.40 (1 H, m), 7.88 - 8.12 (1 H, m)。

【0596】

Reference Example 111

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :7.03-7.31 (7 H, m), 7.32 - 7.58 (4 H, m), 7.95 (2 H, d, J=8.35Hz)。

【0597】

Reference Example 113

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.30 and 4.15 (Each 3 H, each s), 7.09 - 7.48 (6 H, m), 8.23 (1 H, d, J=8.1Hz), 10.00 - 11.42(1 H, m)。

【0598】

Reference Example 114

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.73 and 3.87 (Each 3 H, each s), 7.00 and 7.59 (Each 2 H, each dd, J=8.8Hz, J=2.1Hz), 7.36 - 7.52 (2 H, m), 8.03-8.21 (1 H, m)。

【0599】

Reference Example 116

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.14 and 3.85 (Each 3 H, each s), 7.09 - 7.41 (5 H, m), 7.71 (1 H, d, J=1.4Hz), 7.82 (1 H, dd, J=8.0Hz, J=1.5Hz)。

【0600】

Reference Example 120

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.21-2.06 and 2.48 - 2.82 (All 13 H, m), 2.63 (3 H, s), 4.84 - 6.49 (1 H, m), 6.98 - 7.19 (2 H, m), 7.99 (1 H, d, J=8.7Hz)。

【0601】

参考例 121

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.40-2.23 及び 2.87-3.14(全 9H,m), 2.64(3H,s), 6.98-7.24(2H,m), 8.00(1H,d,J=8.7Hz)。

【0602】

参考例 122

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.49-1.88(4 H,m), 2.08-2.19 及び 2.20-2.52(各 2H,各 m), 6.20-6.40(1H,m), 7.51 及び 7.87(各 2H,各 d,各 J=8.4Hz), 12.42-13.18(1H,m)。

【0603】

参考例 123

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.49-1.68(4 H,m), 1.69-1.91(2H,m), 2.18-2.37(2H,m), 2.45-2.67(2H,m), 6.23(1H,t,J=6.7Hz), 7.42 及び 7.86 (各 2H,各 d,各 J=8.4Hz), 7.28-7.79(1H,m)。

【0604】

参考例 129

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.75(3H,m), 7.29-7.74(7H,m), 8.10-8.22(1H,m)。

【0605】

参考例 138

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.34(3H,t,J=7.2Hz), 4.33(2H,q,J=7.2Hz), 6.80-6.95(1H,m), 7.20-7.35(1H,m), 7.55-7.65(1H,m), 7.98-8.16 (4H,m), 8.45-8.60(2H,m)。

【0606】

参考例 139

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.34(3H,t,J=7.2Hz), 2.29(3H,s), 4.33(2H,q,J=7.2Hz), 7.10-

J=8.7Hz)。

【0601】

Reference Example 121

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.40-2.23 and 2.87 - 3.14 (All 9 H, m), 2.64 (3 H, s), 6.98 - 7.24 (2 H, m), 8.00(1 H, d, J=8.7Hz) .

【0602】

Reference Example 122

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO -d₆); de ppm :1.49-1.88 (4 H, m), 2.08 - 2.19 and 2.20 - 2.52 (Each 2 H, each m), 6.20 - 6.40 (1 H, m), 7.51 and 7.87 (Each 2 H, each d, each J=8.4Hz), 12.42 - 13.18 (1 H, m) .

【0603】

Reference Example 123

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO -d₆); de ppm :1.49-1.68 (4 H, m), 1.69 - 1.91 (2 H, m), 2.18 - 2.37 (2 H, m), 2.45 - 2.67 (2 H, m), 6.23 (1 H, t, J=6.7Hz), 7.42 and 7.86 (Each 2 H, each d, each J=8.4Hz), 7.28 - 7.79 (1 H, m) .

【0604】

Reference Example 129

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.75 (3 H, m), 7.29 - 7.74 (7 H, m), 8.10 - 8.22 (1 H, m) .

【0605】

Reference Example 138

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO -d₆); de ppm :1.34 (3 H, t, J=7.2Hz), 4.33 (2 H, q, J=7.2Hz), 6.80 - 6.95 (1 H, m), 7.20 - 7.35 (1 H, m), 7.55 - 7.65 (1 H, m), 7.98 - 8.16 (4 H, m), 8.45 - 8.60 (2 H, m) .

【0606】

Reference Example 139

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO -d₆); de ppm :1.34 (3 H, t, J=7.2Hz), 2.29 (3 H,

7.20(1H,m), 7.50-7.58(1H,m), 7.95-8.15(4H,m), 8.33(1H,s), 8.43(1H,s)。

【0607】

参考例 140

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.40(3H,t,J=7.2Hz), 4.21(2H,s), 4.37(2H,q,J=7.2Hz), 7.60-7.70(2H,m), 8.00-8.11(2H,m), 8.42(1H,brs)。

【0608】

参考例 141

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.61(3H,s), 3.88(3H,s), 4.20(2H,s), 7.40-7.55(2H,m), 7.90-8.01(1H,m), 8.30(1H,brs)。

【0609】

参考例 142

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:7.40-7.55(1H,m), 7.85-8.03(2H,m), 8.03-8.25(4H,m), 8.85-9.00(2H,m), 12.4-14.1(1H,brs)。

【0610】

参考例 143

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.41(3H,s), 7.75-7.95(2H,m), 7.95-8.25(4H,m), 8.70(1H,s), 8.85(1H,s), 12.6-13.6(1H,brs)。

【0611】

参考例 144

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.07(6H,s), 5.94(2H,s), 7.30-7.40(2H,m), 8.20-8.30(2H,m), 10.7-12.1(1H,brs)。

【0612】

参考例 145

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.70(3H,s), 3.92(3H,s), 7.22-7.35(1H,m), 7.70-7.96(4H,m),

s), 4.33 (2 H, q, J=7.2Hz), 7.10 - 7.20 (1 H, m), 7.50 - 7.58 (1 H, m), 7.95 - 8.15 (4 H, m), 8.33 (1 H, s), 8.43 (1 H, s)。

[0607]

Reference Example 140

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.40 (3 H, t, J=7.2Hz), 4.21 (2 H, s), 4.37 (2 H, q, J=7.2Hz), 7.60 - 7.70 (2 H, m), 8.00 - 8.11(2 H, m), 8.42 (1 H, brs)。

[0608]

Reference Example 141

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.61 (3 H, s), 3.88 (3 H, s), 4.20 (2 H, s), 7.40 - 7.55 (2 H, m), 7.90 - 8.01(1 H, m), 8.30 (1 H, brs)。

[0609]

Reference Example 142

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm :7.40-7.55 (1 H, m), 7.85 - 8.03 (2 H, m), 8.03 - 8.25 (4 H, m), 8.85 - 9.00 (2 H, m), 12.4 - 14.1 (1 H, brs)。

[0610]

Reference Example 143

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm :2.41 (3 H, s), 7.75 - 7.95 (2 H, m), 7.95 - 8.25 (4 H, m), 8.70 (1 H, s), 8.85(1 H, s), 12.6 - 13.6 (1 H, brs)。

[0611]

Reference Example 144

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.07 (6 H, s), 5.94 (2 H, s), 7.30 - 7.40 (2 H, m), 8.20 - 8.30 (2 H, m), 10.7 - 12.1 (1 H, brs)。

[0612]

Reference Example 145

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.70 (3 H, s), 3.92 (3 H, s),

8.03(1H,d,J=8.2Hz), 8.67-8.78(1H,m)。

【0613】

参考例 146

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.92-2.18 及び 3.21-3.45(全 8H,m), 3.85(3H,s), 6.38(1H,dd,J=2.5Hz,J=2.5Hz), 6.52(1H,d,J=2.45Hz), 7.88(1H,d,J=11.3Hz)。

【0614】

参考例 147

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.29(4H,t,J=4.8Hz), 3.84(4H,t,J=5.1Hz), 3.87(3H,s), 6.73(1H,dd,J=2.8Hz,J=2.6Hz), 6.86(1H,d,J=2.7Hz), 7.85(1H,d,J=9.0Hz)。

【0615】

参考例 148

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.60(3H,s), 3.85(3H,s), 5.09(2H,s), 6.72-6.99[2H,m,6.83(1H,s)],7.25-7.48(5H,m), 7.93(1H,d,J=9.1Hz)。

【0616】

参考例 150

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35(6H,d,J=6.1Hz), 2.59(3H,s), 3.85(3H,m), 4.49-4.71(1H,m), 6.61-6.78(2H,m), 7.82-7.98(1H,m)。

【0617】

参考例 151

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.98(3H,t,J=7.8Hz), 1.30-1.89(4H,m), 2.59(3H,s), 3.85(3H,s), 4.13(2H,t,J=6.5Hz), 6.68-6.80(2H,m), 7.83-7.99(1H,m)。

7.22 - 7.35 (1 H, m), 7.70 - 7.96 (4 H, m), 8.03(1 H, d, J=8.2H_Z), 8.67 - 8.78 (1 H, m).

【0613】

Reference Example 146

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.92-2.18 and 3.21 - 3.45 (All 8 H, m), 3.85 (3 H, s), 6.38 (1 H, dd, J=2.5H_Z, J=2.5H_Z), 6.52 (1 H, d, J=2.45H_Z), 7.88(1 H, d, J=11.3H_Z).

【0614】.

Reference Example 147

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :3.29 (4 H, t, J=4.8H_Z), 3.84 (4 H, t, J=5.1H_Z), 3.87 (3 H, s), 6.73 (1 H, dd, J=2.8H_Z, 2.6H_Z), 6.86 (1 H, d, J=2.7H_Z), 7.85 (1 H, d, J=9.0H_Z).

【0615】

Reference Example 148

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :2.60 (3 H, s), 3.85 (3 H, s), 5.09 (2 H, s), 6.72 - 6.99 {2 H, m, 6.83 (1 H, s) }, 7.25 - 7.48(5 H, m), 7.93 (1 H, d, J=9.1H_Z).

【0616】

Reference Example 150

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.35 (6 H, d, J=6.1H_Z), 2.59 (3 H, s), 3.85 (3 H, m), 4.49 - 4.71 (1 H, m), 6.61 - 6.78(2 H, m), 7.82 - 7.98 (1 H, m).

【0617】

Reference Example 151

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :0.98 (3 H, t, J=7.8H_Z), 1.30 - 1.89 (4 H, m), 2.59 (3 H, s), 3.85 (3 H, s), 4.13 (2 H, t, J=6.5H_Z), 6.68- 6.80 (2 H, m), 7.83 - 7.99 (1 H, m).

【0618】

参考例 152

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03(6H,d,J=6.7Hz), 1.98-2.21(1H,m), 2.59(3H,s), 3.75(2H,d,J=6.6Hz), 3.85(3H,s), 6.66-6.81(2H,m), 7.82-7.99(1H,m)。

【0619】

参考例 153

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.94(3H,s), 7.58(1H,dd,J=8.6,2.2Hz), 7.78(1H,d,J=2.2Hz), 7.90(1H,d,J=8.6Hz), 8.32(1H,brs)。

【0620】

参考例 154

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.50(3H,s), 3.78(3H,s), 4.75(2H,s), 6.73-6.93(2H,m), 7.82(1H,d,J=8.5Hz), 13.09(1H,brs)。

【0621】

参考例 156

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.88(3H,s), 3.41-3.50(2H,m), 3.79-3.89(2H,m), 3.89(3H,s), 3.90(3H,s), 7.49(1H,d,J=8.2Hz), 7.87(1H,d,J=1.7Hz), 7.65(1H,dd,J=8.2Hz,1.7Hz)。

【0622】

参考例 157

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.77,3.83 及び 3.93(各 3H,各 s), 6.89-7.08(2H,m), 7.15-7.44(3H,m), 7.54-7.79(2H,m)。

【0623】

参考例 158

【0618】

Reference Example 152

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :1.03 (6 H, d, J=6.7H), 1.98 - 2.21 (1 H, m), 2.59 (3 H, s), 3.75 (2 H, d, J=6.6H), 3.85 (3 H, s), 6.66-6.81 (2 H, m), 7.82 - 7.99 (1 H, m).

【0619】

Reference Example 153

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :3.94 (3 H, s), 7.58 (1 H, dd, J=8.6, 2.2H), 7.78 (1 H, d, J=2.2H), 7.90 (1 H, d, J=8.6H), 8.32 (1 H, brs).

【0620】

Reference Example 154

compound

¹H-nmr (200 MHz,DMSO-d₆);de ppm :2.50 (3 H, s), 3.78 (3 H, s), 4.75 (2 H, s), 6.73 - 6.93 (2 H, m), 7.82 (1 H, d, J=8.5H), 13.09 (1 H, brs).

【0621】

Reference Example 156

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :2.88 (3 H, s), 3.41 - 3.50 (2 H, m), 3.79 - 3.89 (2 H, m), 3.89 (3 H, s), 3.90(3 H, s), 7.49 (1 H, d, J=8.2H), 7.87 (1 H, d, J=1.7H), 7.65 (1 H, dd, J=8.2H,1.7H).

【0622】

Reference Example 157

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :3.77, 3.83 and 3.93 (Each 3 H, each s), 6.89 - 7.08 (2 H, m), 7.15 - 7.44 (3 H, m), 7.54 - 7.79 (2 H, m).

【0623】

Reference Example 158

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:3.84,3.88 及び 3.94(各 3H,各 s), 6.83-6.98(1H,m), 7.02-7.18(2 H,m), 7.27-7.43(2H,m), 7.64(1H,d,J=1.4Hz), 7.71(1H,dd,J=1.6Hz,7.8Hz)。

【0624】

参考例 160

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.79-1.02[9H, m,0.96(s)],1.59(2H,t,J=7.8Hz), 3.86(3H,s), 3.89 (3H,s), 4.23(2H,t,J=7.5Hz), 6.90(1H,dd,J=8.5Hz,8.5Hz), 7.03(1H,s), 7.43(1H,d,J=1.7Hz), 7.80 (1H,d,J=8.5Hz)。

【0625】

参考例 161

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.55(3H,s), 4.53(2H,s), 4.55(2H,s), 7.25-7.55(7H,m), 7.88 (1H,d,J=9Hz), 12.88(1H,s)。

【0626】

参考例 162

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.62(3H,s), 7.70-7.82(1H,m), 7.90-8.13(3H,m), 8.20-8.40 (2H,m), 8.72-8.86(1H,m)。

【0627】

参考例 163

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.85-2.12(4 H,m), 3.12-3.46(4H,m), 6.35-6.62(2H,m), 7.74 (1H,d,J=8.6Hz), 12.35(1H,brs)。

【0628】

参考例 164

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:3.25(4H,t,J=5.0Hz), 3.70(4H,t,J=5.0Hz), 6.80-7.09(2H,m),

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :3.84, 3.88 and 3.94 (Each 3 H, each s), 6.83 - 6.98 (1 H, m), 7.02 - 7.18 (2 H, m), 7.27 -7.43 (2 H, m), 7.64 (1 H, d, J=1.4Hz), 7.71 (1 H, dd, J=1.6Hz, 7.8Hz)。

【0624】

Reference Example 160

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :0.79-1.02 {9 H, m, 0.96 (s) }, 1.59 (2 H, t, J=7.8Hz), 3.86 (3 H, s), 3.89 (3 H, s), 4.23 (2 H, t, J=7.5Hz), 6.90 (1 H, dd, J=8.5Hz, 8.5Hz), 7.03 (1 H, s), 7.43 (1 H, d, J=1.7Hz), 7.80 (1 H, d, J=8.5Hz)。

【0625】

Reference Example 161

compound

¹H-nmr (200 MHz,DMSO-d₆);de ppm :2.55 (3 H, s), 4.53 (2 H, s), 4.55 (2 H, s), 7.25 - 7.55 (7 H, m), 7.88 (1 H, d, J=9Hz),12.88 (1 H, s)。

【0626】

Reference Example 162

compound

¹H-nmr (200 MHz,DMSO-d₆);de ppm :2.62 (3 H, s), 7.70 - 7.82 (1 H, m), 7.90 - 8.13 (3 H, m), 8.20 - 8.40 (2 H, m),8.72 - 8.86 (1 H, m)。

【0627】

Reference Example 163

compound

¹H-nmr (200 MHz,DMSO-d₆);de ppm :1.85-2.12 (4 H, m), 3.12 - 3.46 (4 H, m), 6.35 - 6.62 (2 H, m), 7.74 (1 H, d, J=8.6Hz), 12.35(1 H, brs)。

【0628】

Reference Example 164

compound

¹H-nmr (200 MHz,DMSO-d₆);de ppm :3.25 (4 H, t,

7.75(1H,d,J=8.7Hz)。

【0629】

参考例 166

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.26(6H,d,J=6.0Hz), 2.49(3H,s), 4.56-4.80(1H,m), 6.69-6.85(2H,m), 7.75-7.85(1H,m), 12.39(1H,s)。

【0630】

参考例 167

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.93(3H,t,J=7.3Hz), 1.33-1.55(2H,m), 1.57-1.81(2H,m), 2.51(3H,s), 4.01(2H,t,J=6.4Hz), 6.72-6.90(2H,m), 6.83(1H,s), 7.82(1H,d,J=7.6Hz), 12.41(1H,s)。

【0631】

参考例 168

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.96(6H,d,J=6.7Hz), 1.87-2.15(1H,m), 2.50(3H,s), 3.78(2H,d,J=6.5Hz), 6.72-6.88(2H,m), 6.82(1H,s), 7.81(1H,d,J=7.8Hz), 12.40(1H,brs)。

【0632】

参考例 169

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.97(6H,d,J=6.6Hz), 1.23(3H,t,J=7.0Hz), 1.85-2.10(1H,m), 3.13(2H,d,J=7.5Hz), 3.39(2H,q,J=7Hz), 6.54(1H,s), 7.36(1H,dd,J=8.7Hz,2.2Hz), 7.63(1H,d,J=2.2Hz), 7.98(1H,d,J=8.7Hz)。

【0633】

参考例 170

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.57(3H,s), 5.17(2H,s), 6.58-6.92 及び 6.93-8.03(全 12H,

J=5.0Hz), 3.70(4H,t,J=5.0Hz), 6.80-7.09(2H,m), 7.75(1H,d,J=8.7Hz)。

【0629】

Reference Example 166

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); δ ppm: 1.26 (6 H, d, J=6.0 Hz), 2.49 (3 H, s), 4.56 - 4.80 (1 H, m), 6.69 - 6.85 (2 H, m), 7.75 - 7.85 (1 H, m), 12.39 (1 H, s).

【0630】

Reference Example 167

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); δ ppm: 0.93 (3 H, t, J=7.3 Hz), 1.33 - 1.55 (2 H, m), 1.57 - 1.81 (2 H, m), 2.51 (3 H, s), 4.01 (2 H, t, J=6.4 Hz), 6.72 - 6.90 (2 H, m), 6.83 (1 H, s), 7.82 (1 H, d, J=7.6 Hz), 12.41 (1 H, s).

【0631】

TRANSLATION STALLEDReference Example 168

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); δ ppm: 0.96 (6 H, d, J=6.7 Hz), 1.87 - 2.15 (1 H, m), 2.50 (3 H, s), 3.78 (2 H, d, J=6.5 Hz), 6.72 - 6.88 (2 H, m), 6.82 (1 H, s), 7.81 (1 H, d, J=7.8 Hz), 12.40 (1 H, brs).

【0632】

Reference Example 169

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); δ ppm: 0.97 (6 H, d, J=6.6 Hz), 1.23 (3 H, t, J=7.0 Hz), 1.85 - 2.10 (1 H, m), 3.13 (2 H, d, J=7.5 Hz), 3.39 (2 H, q, J=7 Hz), 6.54 (1 H, s), 7.36 (1 H, dd, J=8.7 Hz, 2.2 Hz), 7.63 (1 H, d, J=2.2 Hz), 7.98 (1 H, d, J=8.7 Hz).

【0633】

Reference Example 170

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); δ ppm: 2.57 (3 H, s), 5.17 (2 H, s), 6.58 -

m), 12.56-12.94(1H,m)。

【0634】

参考例 171

の化合物

¹H-NMR(250MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.84(2H,t,J=4.6Hz), 3.70(2H,t,J=4.6Hz), 4.64(2H,s), 7.17(4H,s), 7.54(1H,dd,J=7Hz,1.6Hz), 7.76-7.83(2H,m), 9.01(1H,s)。

【0635】

参考例 172

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.83(6H,d,J=6.6Hz), 1.68-1.97(1H,m), 2.42(2H,d,J=7.2Hz), 2.48(3H,s), 6.93-7.13(2H,m), 7.74(1H,d,J=8.5Hz)。

【0636】

参考例 173

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.61(3H,s), 4.10-5.40(2H,brs), 7.32-7.90(4H,m), 7.95(1H,d,J=8.2Hz), 9.22(1H,d,J=5.8Hz)。

【0637】

参考例 174

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.86(2H,t,J=5.8Hz), 3.67(2H,t,J=5.8Hz), 3.89(3H,s), 4.63(2H,s), 7.18(4H,s), 7.4-7.6(2H,m), 7.84(1H,s), 7.95(1H,d,J=8.2Hz)。

【0638】

参考例 178

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.93(9H,s), 1.55(2H,t,J=7.5Hz), 3.76(3H,s), 4.15(2H,t,J=7.4Hz), 7.05(1H,dd,J=8.6Hz,8.6Hz), 7.64(1H,d,J=8.9Hz), 7.34(1H,d,J=1.6Hz), 9.88(1H,s)。

6.92 and 6.93 - 8.03 (All 12 H, m), 12.56- 12.94 (1 H, m)。

【0634】

Reference Example 171

compound

¹H-nmr (250 MHz, DMSO-d₆); de ppm :2.84 (2 H, t, J=4.6 Hz), 3.70 (2 H, t, J=4.6 Hz), 4.64 (2 H, s), 7.17 (4 H, s), 7.54 (1 H, dd, J=7 Hz, 1.6 Hz), 7.76 - 7.83 (2 H, m), 9.01 (1 H, s)。

【0635】

Reference Example 172

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm :0.83 (6 H, d, J=6.6 Hz), 1.68 - 1.97 (1 H, m), 2.42 (2 H, d, J=7.2 Hz), 2.48 (3 H, s), 6.93 - 7.13 (2 H, m), 7.74 (1 H, d, J=8.5 Hz)。

【0636】

Reference Example 173

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm :2.61 (3 H, s), 4.10 - 5.40 (2 H, brs), 7.32 - 7.90 (4 H, m), 7.95 (1 H, d, J=8.2 Hz), 9.22 (1 H, d, J=5.8 Hz)。

【0637】

Reference Example 174

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm :2.86 (2 H, t, J=5.8 Hz), 3.67 (2 H, t, J=5.8 Hz), 3.89 (3 H, s), 4.63 (2 H, s), 7.18 (4 H, s), 7.4 - 7.6 (2 H, m), 7.84 (1 H, s), 7.95 (1 H, d, J=8.2 Hz)。

【0638】

Reference Example 178

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm :0.93 (9 H, s), 1.55 (2 H, t, J=7.5 Hz), 3.76 (3 H, s), 4.15 (2 H, t, J=7.4 Hz), 7.05 (1 H, dd, J=8.6 Hz, 8.6 Hz), 7.64 (1 H, d, J=8.9 Hz), 7.34 (1 H, d, J=1.6 Hz), 9.88 (1 H, s)。

【0820】

実施例 143

と同様にして適当な出発原料を用いて前記実施例 79,及び 101 の化合物を得た。

【1120】

実施例 147

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-3.55 及び 4.50-5.10[全 16H,m,2.20(s), 2.39(s), 4.69(s)],6.54(1H,d,J=8.27Hz), 6.71(1H,d,J=12.82Hz), 6.78-6.95(1H,m), 7.05-7.50 及び 7.75-8.20(全 3H,m)。

【1121】

実施例 148

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.98-3.94,4.41-4.61 及び 5.03-5.19[全 24H,m,1.12(t,J=6.67Hz), 4.57(s)],6.38-7.52 及び 8.16-8.38(全 13H,m)。

【1122】

実施例 150

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.86-3.91,4.36-4.61 及び 5.00-5.20[全 27H,m,1.12(t,J=7.08Hz), 2.34(s), 4.54(s)],7.39-7.53 及び 8.14-8.42(全 12H,m)。

【1123】

実施例 151

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.90-4.24,4.52-4.81 及び 5.08-5.24[全 27H,m,1.25(t,J=7.27), 2.60(s), 4.67(s),4.76(s)],6.48-7.71 及び 8.25-8.62(全 12H,m)。

【1124】

実施例 152

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.93-4.18,4.35-4.69 及び 5.00-5.21[全 27H,m,1.12(t,J=6.62Hz),

9.88 (1 H, s).

【0820】

Working Example 143

With to similar aforementioned Working Example 79, and compound of 101 wereacquired making use of suitable starting material .

{1120}

Working Example 147

compound

¹H-nmr (200 MH_Z , CDCl₃);de ppm :1.35-3.55 and 4.50 - 5.10 {All 16 H, m, 2.20 (s), 2.39 (s), 4.69 (s) }, 6.54 (1 H, d, J=8.27H_Z), 6.71 (1 H, d, J=12.82H_Z), 6.78 - 6.95(1 H, m), 7.05 - 7.50 and 7.75 - 8.20 (All 3 H, m).

{1121}

Working Example 148

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.98-3.94, 4.41-4.61 and 5.03 - 5.19 {All 24 H, m, 1.12 (t, J=6.67Hz), 4.57 (s) }, 6.38 - 7.52 and 8.16 - 8.38 (All 13 H, m).

{1122}

Working Example 150

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.86-3.91, 4.36-4.61 and 5.00 - 5.20 {All 27 H, m, 1.12 (t, J=7.08Hz), 2.34 (s), 4.54 (s) }, 7.39 - 7.53 and 8.14 - 8.42 (All 12 H, m).

{1123}

Working Example 151

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.90-4.24, 4.52-4.81 and 5.08 - 5.24 {All 27 H, m, 1.25 (t, J=7.27), 2.60 (s), 4.67 (s). 4.76 (s) }, 6.48 - 7.71 and 8.25 - 8.62 (All 12 H, m).

{1124}

Working Example 152

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.93-4.18, 4.35-4.69 and 5.00 - 5.21 {All 27 H, m, 1.12

2.30(s), 4.53(s)], 6.48-7.62 及び 8.18-8.40(全 12 H,m)。

【1125】

実施例 153

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.90-4.18,4.35-4.70 及び 5.05-5.18[全 27H,m,3.89(s), 4.59(s)], 6.45-8.12 及び 8.90-9.25(全 12H,m)。

【1126】

実施例 154

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.95-3.91,4.31-4.68 及び 4.98-5.20[全 27H,m,1.12(t,J=7.20Hz), 3.80(s), 4.53(s)],6.48-7.61 及び 8.29-8.42(全 12 H,m)。

【1127】

実施例 155

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.96-3.94,4.40-4.62 及び 5.00-5.20[全 27H,m,1.12(t,J=7.18Hz), 2.33(s), 4.56(s)],6.50-7.60 及び 8.34-8.48(全 12 H,m)。

【1128】

実施例 156

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.96-3.92,4.31-4.62 及び 5.0-5.21[全 27H,m,1.12(t,J=7.24Hz), 3.77(s), 4.50(s)],6.45-7.65 及び 8.32-8.52(全 12 H,m)。

【1129】

実施例 157

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.84-4.15,4.39-4.62 及び 5.05-5.40[全 24H,m,1.11(t,J=5.70Hz), 5.15(s), 5.29(s)],6.54(1H,d,J=6.48Hz), 6.78(1H, d,J=6.66Hz), 6.98-7.75 及び 7.95-8.12[全 11H, m,7.35(s), 7.99(s)]。

【1130】

実施例 158

の化合物

(t, J=6.62Hz), 2.30 (s), 4.53 (s) }, 6.48 - 7.62 and 8.18 - 8.40 (All 12 H, m) .

{1125}

Working Example 153

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.90-4.18, 4.35-4.70 and 5.05 - 5.18 {All 27 H, m, 3.89 (s), 4.59 (s) }, 6.45 - 8.12 and 8.90 - 9.25 (All 12 H, m) .

{1126}

Working Example 154

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.95-3.91, 4.31 -4.68 and 4.98 - 5.20 {All 27 H, m, 1.12 (t, J=7.20Hz), 3.80 (s), 4.53 (s) }, 6.48 - 7.61 and 8.29 - 8.42 (All 12 H, m) .

{1127}

Working Example 155

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.96-3.94, 4.40-4.62 and 5.00 - 5.20 {All 27 H, m, 1.12 (t, J=7.18Hz), 2.33 (s), 4.56 (s) }, 6.50 - 7.60 and 8.34 - 8.48 (All 12 H, m) .

{1128}

Working Example 156

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.96-3.92, 4.31 -4.62 and 5.0 - 5.21 {All 27 H, m, 1.12 (t, J=7.24Hz), 3.77 (s), 4.50 (s) }, 6.45 - 7.65 and 8.32 - 8.52 (All 12 H, m) .

{1129}

Working Example 157

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.84-4.15, 4.39-4.62 and 5.05 - 5.40 {All 24 H, m, 1.11 (t, J=5.70Hz), 5.15 (s), 5.29 (s) }, 6.54 (1 H, d, J=6.48Hz), 6.78 (1 H, d, J=6.66Hz), 6.98 - 7.75 and 7.95 - 8.12 {All 11 H, m, 7.35 (s), 7.99 (s) } .

{1130}

Working Example 158

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.61(3H,d,J=5.16Hz), 0.97(3H,d,J=5.28Hz), 1.12-5.15 及び 5.7-5.86[全 15H,m,2.51(s), 4.63(s)],6.38-8.75[全 12H,m,8.47(s)]。

【1131】

実施例 159

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-4.20 及び 4.31-4.62[全 21H,m,4.53(s), 4.62(s)],2.46(3H,s), 6.35-7.68 及び 8.18-8.56(全 12H,m)。

【1132】

実施例 160

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.81-4.29,4.31-4.71 及び 4.95-5.13[全 28H,m), 1.02(t,J=5.66Hz), 1.15(J=5.78Hz), 4.54(s), 4.63(s)],6.35-7.76 及び 8.23-8.69[全 13H,m,8.53(s)]。

【1133】

実施例 161

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.79-4.72 及び 4.90-5.08[全 22H,m,2.45(s), 4.51(s), 4.61(s)],6.30-7.69 及び 8.21-8.63[全 12H,m,6.38(d,J=6.80Hz), 6.50(d,J=6.66Hz), 8.53(s)]。

【1134】

実施例 162

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.72-4.01,4.31-4.73 及び 4.89-5.18[全 14H,m,2.50(s), 4.52(s), 4.64(s), 5.04(s)],5.80-7.70 及び 8.12-8.58[全 12H,m,6.54(d,J=6.64Hz), 8.42(s)]。

【1135】

実施例 163

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.81-3.59[全 15H,m,1.22(t,J=5.96Hz), 2.39(s), 2.98(q,J=5.94Hz)],4.75-5.05(1H,m), 6.50-7.62[全 8H,m,6.60(d,J=6.20Hz), 6.85(t,J=6.10Hz), 7.01(t,J=5.96Hz), 7.56(s)]。

【1136】

実施例 165

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.61 (3 H, d, J=5.16Hz), 0.97 (3 H, d, J=5.28Hz), 1.12 - 5.15 and 5.76 - 5.86 {All 15 H, m, 2.51 (s), 4.63 (s) }, 6.38 -8.75 {All 12 H, m, 8.47 (s) }.

{1131}

Working Example 159

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.11-4.20 and 4.31 - 4.62 {All 21 H, m, 4.53 (s), 4.62 (s) }, 2.46 (3 H, s), 6.35 - 7.68 and 8.18 -8.56 (All 12 H, m) .

{1132}

Working Example 160

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.81-4.29, 4.31 -4.71 and 4.95 - 5.13 {All 28 H, m) , 1.02 (t, J=5.66Hz) , 1.15 (J=5.78Hz) , 4.54 (s) , 4.63 (s) }, 6.35 - 7.76 and 8.23 - 8.69 {All 13 H, m, 8.53 (s) }.

{1133}

Working Example 161

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.79-4.72 and 4.90 - 5.08 {All 22 H, m, 2.45 (s), 4.51 (s) , 4.61 (s) }, 6.30 - 7.69 and 8.21 - 8.63 {All 12 H, m, 6.38 (d, J=6.80Hz) , 6.50 (d, J=6.66Hz) , 8.53 (s) }.

{1134}

Working Example 162

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.72-4.01, 4.31 -4.73 and 4.89 - 5.18 {All 14 H, m, 2.50 (s) , 4.52 (s) , 4.64 (s) , 5 and 04 (s) }, 5.80 - 7.70 and 8.12 - 8.58 {All 12 H, m, 6.54 (d, J=6.64Hz) , 8.42 (s) }.

{1135}

Working Example 163

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.81-3.59 {All 15 H, m, 1.22 (t, J=5.96Hz) , 2.39 (s) , 2.98 (q, J=5.94Hz) }, 4.75 - 5.05 (1 H, m) , 6.50 - 7.62 {All 8 H, m, 6.60 (d, J=6.20Hz) , 6.85 (t, J=6.10Hz) , 7.01 (t, J=5.96Hz) , 7.56 (s) }.

{1136}

Working Example 165

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.36-1.15, 1.35-3.89 及び 4.98-5.09[全 30H,m,2.27(s), 2,29(s)],5.65-6.70(全 11H,m)。

【1137】

実施例 167

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.92(6H,d,J=5.36Hz), 1.35-3.13,3.28-3.58,3.69-4.01 及び 4.82-5.09[全 14H,m,2.40(s), 3.88(d,J=5.24Hz)],6.42-7.40[全 8H,m,7.00(t,J=5.84Hz)]。

【1138】

実施例 173

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.01-4.10,4.41-4.68 及び 4.92-5.15[全 26H,m), 2.33(s), 2.52(s), 3.88(s)],6.35-7.60[全 10H,m,6.59(d,J=8.35Hz)]。

【1139】

実施例 174

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.01-4.12,4.45-4.70 及び 4.92-5.16[全 26H,m,2.33(s), 2.53(s), 3.88(s)],6.41-7.63(全 11H,m)。

【1140】

実施例 175

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.52(3H,d,J=6.52Hz), 0.96(3H,d,J=6.59Hz), 1.05-2.15,2.21-4.67 及び 5.60-5.76[全 16H,m,2.59(s), 3.88(s)],6.29-7.62(全 11H,m)。

【1141】

実施例 176

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.20,2.49-4.61 及び 5.01-5.28[全 17H,m,3.74(s), 3.77(s), 4.51(s)],6.38-7.60 及び 8.21-8.49[全 12H,m,6.55(d,J=8.32Hz)]。

【1142】

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.36-1.15, 1.35-3.89 and 4.98 - 5.09 {All 30 H, m, 2.27 (s) , 2 and 29 (s) } , 5.65 - 6.70 (All 11 H, m) .

{1137}

Working Example 167

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.92 (6 H, d, J=5.36Hz) , 1.35 - 3. 13 and 3. 28 - 3. 58 and 3. 69 -4.01 and 4.82 - 5.09 {All 14 H, m, 2.40 (s) , 3.88 (d, J=5.24Hz) } , 6.42 - 7.40 {All 8 H, m, 7.00 (t, J=5.84Hz) } .

{1138}

Working Example 173

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.01-4.10, 4, 41-4.68 and 4.92 - 5.15 {All 26 H, m) , 2.33 (s) , 2.52 (s) , 3.88 (s) } , 6.35 - 7.60 {All 10 H, m, 6.59 (d, J=8.35Hz) } .

{1139}

Working Example 174

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.01-4.12, 4.45-4.70 and 4.92 - 5.16 {All 26 H, m, 2.33 (s) , 2.53 (s) , 3.88 (s) } , 6.41 - 7.63 (All 11 H, m) .

{1140}

Working Example 175

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.52 (3 H, d, J=6.52Hz) , 0.96 (3 H, d, J=6.59Hz) , 1.05 - 2. 15 and 2. 21 - 4.67 and5.60 - 5.76 {All 16 H, m, 2.59 (s) , 3.88 (s) } , 6.29 - 7.62 (All 11 H, m) .

{1141}

Working Example 176

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.20, 2.49-4.61 and 5.01 - 5.28 {All 17 H, m, 3.74 (s) , 3.77 (s) , 4.51 (s) } , 6.38 - 7.60 and 8.21 - 8.49 {All 12 H, m, 6.55 (d, J=8.32Hz) } .

{1142}

実施例 177

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.18-2.31, 2.51-3.96 及び 4.26-5.51[全 15H, m, 3.77(s), 4.53(s)], 6.40-6.69, 6.81-7.00, 7.08-7.51 及び 8.25-8.41(全 12H, m)。

【1143】

実施例 179

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.21-2.30, 2.55-3.96 及び 4.25-5.80[全 15H, m, 3.76(s), 4.49(s)], 6.39-6.65, 6.78-7.51 及び 8.25-8.45[全 12H, m, 6.55(s), $J=8.32\text{Hz}$]。

【1144】

実施例 180

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.15-4.65 及び 5.05-5.21[全 18H, m, 2.51(s), 3.84(s), 3.88(s)], 6.40-7.42[全 10H, m], 6.60(d, $J=7.62\text{Hz}$)。

【1145】

実施例 181

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.14-4.36, 4.45-4.83 及び 5.0-5.25[全 18H, m], 2.56(s), 3.71(s), 3.81(s)], 6.43-7.78[全 11H, m], 6.68(d, $J=7.67\text{Hz}$)。]

【1146】

実施例 182

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.20-2.30, 2.45-3.94 及び 4.44-4.65[全 12H, m, 2.52(s), 3.72(s)], 6.42-6.77(1H, m), 6.80-7.55(6H, m), 8.35-8.75(2H, m)。

【1147】

実施例 183

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.19-4.01, 4.42-4.69 及び 5.0-5.21[全 15H, m, 2.55(s), 3.81(s)], 7.49-7.60(全 11H, m)。

【1148】

Working Example 177

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3); de ppm : 1.18-2.31, 2.51-3.96 and 4.26 - 5.51 {All 15 H, m, 3.77 (s), 4.53 (s)}, 6.40 - 6.69 and 6.81 - 7.00 and 7.08 - 7.51 and 8.25 - 8.41 (All 12 H, m) .

{1143}

Working Example 179

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3); de ppm : 1.21-2.30, 2.55-3.96 and 4.25 - 5.80 {All 15 H, m, 3.76 (s), 4.49 (s)}, 6.39 - 6.65 and 6.78 - 7.51 and 8.25 - 8.45 {All 12 H, m, 6.55 (s), $J=8.32\text{Hz}$ } } .

{1144}

Working Example 180

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3); de ppm : 1.15-4.65 and 5.05 - 5.21 {All 18 H, m, 2.51 (s), 3.84 (s), 3.88 (s)}, 6.40 - 7.42 {All 10 H, m}, 6.60 (d, $J=7.62\text{Hz}$) } .

{1145}

Working Example 181

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3); de ppm : 1.14-4.36, 4.45-4.83 and 5.0 - 5.25 {All 18 H, m}, 2.56 (s), 3.71 (s), 3.81 (s)}, 6.43 - 7.78 {All 11 H, m}, 6.68 (d, $J=7.67\text{Hz}$) } .

{1146}

Working Example 182

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3); de ppm : 1.20-2.30, 2.45-3.94 and 4.44 - 4.65 {All 12 H, m, 2.52 (s), 3.72 (s)}, 6.42 - 6.77 (1 H, m), 6.80 - 7.55 (6 H, m), 8.35 - 8.75 (2 H, m) .

{1147}

Working Example 183

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3); de ppm : 1.19-4.01, 4.42-4.69 and 5.0 - 5.21 {All 15 H, m, 2.55 (s), 3.81 (s)}, 7.49 - 7.60 (All 11 H, m) .

{1148}

実施例 184

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.06-4.05,4.39-4.65 及び 4.99-5.20[全 15H,m), 2.50(s), 3.80(s)],6.35-7.52[全 10H,m), 6.72(d,J=7.32Hz)]。

【1149】

実施例 185

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-3.65,3.92-4.30 及び 4.80-5.10[全 13H,m), 2.43(s), 4.10(s)],6.46-7.58 及び 8.01-8.49[全 7H,m,6.62(d,J=5.48Hz), 6.74(d,J=6.66Hz)]。

【1150】

実施例 186

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-4.78 及び 5.02-5.20[全 14H,m,2.44(s), 4.62(s)],6.44-7.15 及び 8.19-8.51[全 12H,m,6.55(d,J=8.36Hz)]。

【1151】

実施例 187

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-2.30,2.52-3.31,3.42-4.78 及び 5.09-5.28[全 17H,m,3.74(s), 3.91(s), 4.61(s)],6.42-7.58 及び 8.85-9.10[全 12H,m,5.80(d,J=8.36Hz)]。

【1152】

実施例 188

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-4.80 及び 5.09-5.18[全 14H,m,3.88(s), 4.59(s)],5.72-7.60 及び 8.87-9.12[全 13H,m,6.56(d,J=8.4Hz)]。

【1153】

実施例 189

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-4.23,4.38-4.68 及び 5.03-5.19[全 17H,m,3.74(s), 3.79(s), 4.54(s)],6.31-7.80 及び 8.10-8.71(全 12H,m)。

Working Example 184

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.06-4.05, 4.39-4.65 and 4.99 - 5.20 {All 15 H, m), 2.50 (s), 3.80 (s) }, 6.35 - 7.52 {All 10 H, m), 6.72 (d, J=7.32Hz) }.

{1149}

Working Example 185

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-3.65, 3.92-4.30 and 4.80 - 5.10 {All 13 H, m), 2.43 (s), 4.10 (s) }, 6.46 - 7.58 and 8.01 - 8.49 {All 7 H, m, 6.62 (d, J=5.48Hz), 6.74 (d, J=6.66Hz) }.

{1150}

Working Example 186

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.11-4.78 and 5.02 - 5.20 {All 14 H, m, 2.44 (s), 4.62 (s) }, 6.44 - 7.15 and 8.19 - 8.51 {All 12 H, m, 6.55 (d, J=8.36Hz) }.

{1151}

Working Example 187

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-2.30, 2.52-3.31 , 3.42-4.78 and 5.09 - 5.28 {All 17 H, m, 3.74 (s), 3.91 (s), 4.61 (s) }, 6.42 - 7.58 and 8.85 - 9.10 {All 12 H, m, 5.80 (d, J=8.36Hz) }.

{1152}

Working Example 188

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-4.80 and 5.09 - 5.18 {All 14 H, m, 3.88 (s), 4.59 (s) }, 5.72 - 7.60 and 8.87 - 9.12 {All 13 H, m, 6.56 (d, J=8.4Hz) }.

{1153}

Working Example 189

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.08-4.23, 4.38-4.68 and 5.03 - 5.19 {All 17 H, m, 3.74 (s), 3.79 (s), 4.54 (s) }, 6.31 - 7.80 and 8.10 - 8.71 (All 12 H, m) .

【1154】

実施例 190

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-3.29,3.41-4.69 及び 5.07-5.27[全 17H,m,2.34(s), 3.74(s), 4.57(s)],6.43-7.71 及び 8.21-8.50[全 12H,m,6.58(d,J=6.36Hz), 6.85(d,J=8.21Hz)]。

【1155】

実施例 192

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.09-3.85,4.01-4.71 及び 5.01-5.20[全 17H,m,2.46(s), 3.74(s), 4.64(s)],6.31-7.65 及び 8.05-8.41[全 13H,m,6.55(d,J=8.34Hz)]。

【1156】

実施例 193

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-4.73 及び 5.03-5.26[全 11H,m,4.57(s)],6.49-7.52 及び 8.20-8.41[全 13H,m,6.55(d,J=8.39Hz)]。

【1157】

実施例 194

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-3.90,4.28-4.72 及び 5.09-5.26[全 14H,m,2.28(s), 4.51(s)], 5.60-7.50 及び 8.20-8.45[全 13H,m,6.55(d,J=8.58Hz)]。

【1158】

実施例 195

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-4.65 及び 5.03-5.26[全 14H,m,2.33(s), 4.54(s)],6.40-7.51 及び 8.21-8.43[全 12H,m,6.55(d,J=8.06Hz)]。

【1159】

実施例 196

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-2.31,2.49-4.65 及び 5.08-5.26[全 14H,m,3.74(s), 4.57(s)], 6.45-6.67,6.80-7.68 及び 7.92-8.43[全 13H,m,6.57(d,J=8.22Hz)]。

{1154}

Working Example 190

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-3.29, 3.41-4.69 and 5.07 - 5.27 {All 17 H, m, 2.34 (s) , 3.74 (s) , 4.57 (s) } , 6.43 - 7.71 and 8.21 - 8.50 {All 12 H, m, 6.58 (d, J=6.36Hz) , 6.85 (d, J=8.21Hz) } .

{1155}

Working Example 192

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.09-3.85, 4.01-4.71 and 5.01 - 5.20 {All 17 H, m, 2.46 (s) , 3.74 (s) , 4.64 (s) } , 6.31 - 7.65 and 8.05 - 8.41 {All 13 H, m, 6.55 (d, J=8.34Hz) } .

{1156}

Working Example 193

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-4.73 and 5.03 - 5.26 {All 11 H, m, 4.57 (s) } , 6.49 - 7.52 and 8.20 - 8.41 {All 13 H, m, 6.55 (d, J=8.39Hz) } .

{1157}

Working Example 194

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-3.90, 4.28-4.72 and 5.09 - 5.26 {All 14 H, m, 2.28 (s) , 4.51 (s) } , 5.60 - 7.50 and 8.20 - 8.45 {All 13 H, m, 6.55 (d, J=8.58Hz) } .

{1158}

Working Example 195

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.12-4.65 and 5.03 - 5.26 {All 14 H, m, 2.33 (s) , 4.54 (s) } , 6.40 - 7.51 and 8.21 - 8.43 {All 12 H, m, 6.55 (d, J=8.06Hz) } .

{1159}

Working Example 196

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-2.31 , 2.49-4.65 and 5.08 - 5.26 {All 14 H, m, 3.74 (s) , 4.57 (s) } , 6.45 - 6.67 and 6.80 - 7.68 and 7.92 - 8.43 {All 13 H, m, 6.57 (d, J=8.22Hz) } .

【1160】

実施例 197

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-2.22 及び 2.41-5.95(全 9H,m), 5.14(2H,s), 6.62-6.48 及び 6.75-7.59[全 13H,m,6.52(d,J=8.24Hz), 7.34(s)]。

【1161】

実施例 198

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-4.70 及び 5.03-5.25[全 17H,m,2.30(s), 3.74(s), 4.53(s)], 6.41-7.65 及び 7.91-8.43[全 13H,m,6.56(d,J=8.41 Hz)]。

【1162】

実施例 199

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.22,2.48-3.29 及び 3.41-4.80[全 14H,m,3.67(s), 3.72(s)], 5.16(2H,s), 6.15-6.20,6.40-6.68,6.75-8.40 及び 9.31-9.48[全 13H,m,6.55(d,J=8.24Hz), 7.36(s)]。

【1163】

実施例 201

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.25 及び 2.70-3.25(全 7.2H,m), 3.45(2.5H,s), 3.52(0.5H,s), 3.94(1.7H,s), 4.03(0.3H,s), 4.75-5.10(0.8H,m), 6.75-7.95(7.2H,m), 8.18(0.7H,s), 8.40(0.1 H,s)。

【1164】

実施例 202

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.10-5.0(28 H,m), 6.60-7.80(11H,m), 10.0-10.5(1H,m), 11.0-11.8(1H,m)。

【1165】

実施例 203

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.25,2.60-3.15 及び 4.85-5.05(全 8H,m), 2.45 及び 2.49(全

{1160}

Working Example 197

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.11-2.22 and 2.41 - 5.95 (All 9 H, m), 5.14 (2 H, s), 6.62 - 6.48 and 6.75 -7.59 {All 13 H, m, 6.52 (d, J=8.24Hz), 7.34 (s) }.

{1161}

Working Example 198

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.13-4.70 and 5.03 - 5.25 {All 17 H, m, 2.30 (s), 3.74 (s), 4.53 (s) }, 6.41 - 7.65 and 7.91 - 8.43 {All 13 H, m, 6.56 (d, J=8.41Hz) }.

{1162}

Working Example 199

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.22, 2.48-3.29 and 3.41 - 4.80 {All 14 H, m, 3.67 (s), 3.72 (s) }, 5.16 (2 H, s), 6.15 - 6. 20 and 6.40 - 6. 68 and 6. 75 - 8.40 and 9.31 - 9.48 {All 13 H, m, 6.55 (d, J=8.24Hz), 7.36 (s) }.

{1163}

Working Example 2 01

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-2.25 and 2.70 - 3.25 (All 7.2 H, m), 3.45 (2.5 H, s), 3.52 (0.5 H, s), 3.94 (1.7 H, s), 4.03(0.3 H, s), 4.75 - 5.10 (0.8 H, m), 6.75 - 7.95 (7.2 H, m), 8.18 (0.7 H, s), 8.40 (0.1 H, s) .

{1164}

Working Example 2 02

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.10-5.0 (28 H, m), 6.60 - 7.80 (11 H, m), 10.0 - 10.5 (1 H, m), 11.0 - 11.8 (1 H, m) .

{1165}

Working Example 2 03

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-2.25, 2.60-3.15 and 4.85 - 5.05 (All 8 H, m), 2.45

3H,各 s), 2.95 及び 2.97(全 6H,各 s), 4.53 及び 4.65(全 2H,各 s), 6.26-7.55(11.3H,m), 8.17(0.7 H,s)。

【1166】

実施例 205

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.20-3.80 及び 4.30-4.60[全 23H,m,2.34(s), 2.37(s)],4.63 及び 4.73(全 2H,各 s), 6.40-7.80(12H,m), 10.1 及び 10.35(全 1H,各 s), 10.7-11.4(1H,m)。

【1167】

実施例 206

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.10-4.90 [全 28H,m,4.64(s), 4.66(s), 4.77(s), 4.86(s)],6. 65-8.05(12H,m), 10.4-11.5(2H,m)。

【1168】

実施例 207

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.20-2.10 及び 2.70-4.90[全 25H,m,3.70(s)],1.87(3H,s), 6. 50-7.70(11H,m), 10.1-11.4(2H,m)。

【1169】

実施例 208

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.20,2.20- 3.20,3.20-4.0 及び 4.30-4.50[全 25H,m,2.29(s)], 5.70-6.10,6.51-7.40 及び 7.40-8.00(全 13H,m)。

【1170】

実施例 209

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.15,2.70- 3.10 及び 4.80-5.00(全 10H,m), 3.66 及び 3.76 [全 2H,各 t,J=5.8Hz],4.60 及び 4.71[全 2H,各 s], 6.70-7.50(12H,m)。

【1171】

実施例 210

and 2.49 (All 3 H, each s), 2.95 and 2.97(All 6 H, each s), 4.53 and 4.65 (All 2 H, each s), 6.26 - 7.55 (11.3 H, m), 8.17 (0.7 H, s) .

{1166}

Working Example 2 05

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.20-3.80 and 4.30 - 4.60 {All 23 H, m, 2.34 (s) , 2.37 (s) } , 4.63 and 4.73 (All 2 H, each s) , 6.40 - 7.80(12 H, m) , 10.1 and 10 .35 (All 1 H, each s) , 10.7 - 11.4 (1 H, m) .

{1167}

Working Example 2 06

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.10-4.90 {All 28 H, m, 4.64 (s) , 4.66 (s) , 4.77 (s) , 4.86 (s) } , 6.65 - 8.05 (12 H, m) , 10.4 - 11.5 (2 H, m) .

{1168}

Working Example 2 07

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.20-2.10 and 2.70 - 4.90 {All 25 H, m, 3.70 (s) } , 1.87 (3 H, s) , 6.50 - 7.70 (11 H, m) , 10.1 -11.4 (2 H, m) .

{1169}

Working Example 2 08

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-2.20, 2.20-3.20, 3.20-4.0 and 4.30 - 4.50 {All 25 H, m, 2.29 (s) } , 5.70 - 6. 10 and 6. 51 - 7.40and 7.40 - 8.00 (All 13 H, m) .

{1170}

Working Example 2 09

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-2.15, 2.70-3.10 and 4.80 - 5.00 (All 10 H, m) , 3.66 and 3.76 {All 2 H, each t, J=5.8Hz } , 4.60 and 4.71 {All 2 H, each s } , 6.70 - 7.50 (12 H, m) .

{1171}

Working Example 2 10

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.30,2.70-3.20 及び 4.40-5.20(全 10H,m), 6.25-8.10(13H,m)。

【1172】

実施例 211

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.20,2.70-3.15,3.20-3.60,3.90-4.25 及び 4.85-5.05(全 13H,m), 6.21(0.6H,dd,J=8.4Hz,J=2.2Hz), 6.50(0.7H,d,J=1.8Hz), 6.70(0.9H,d,J=8.4Hz), 6.80-7.40(9.8H,m)。

【1173】

実施例 214

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-4.60[全 20H,m,2.33(s)],5.15 及び 5.21(全 2H,各 s), 6.70-8.10(12H,m)。

【1174】

実施例 220

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-1.75(1H,m), 1.85-2.25(3H,m), 2.75-3.25(3H,m), 4.58(2H,d,J=5.6Hz), 4.9-5.1(1H,m), 6.3-6.5(1H,m), 6.58(1H,d,J=7.4Hz), 6.87(1H,t,J=7.6Hz), 7.06(1H,t,J=7.3Hz), 7.19-7.32(8H,m), 7.55(2H,d,J=8.3Hz)。

【1175】

実施例 228

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.20,2.30-3.35,3.60-3.90 及び 4.40-4.70[全 14H,m,2.45(s), 4.48(s)],6.45-7.60(12H,m), 8.28 及び 8.49(全 1H,各 s)。

【1176】

実施例 229

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.30-2.30,2.70-3.90 及び 4.40-4.60(全 9H,m), 4.62 及び 4.64(全 2H,各 s), 6.80-7.65(12.5H,m), 8.48 及び 8.75(全 0.5H,各 s)。

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-2.30, 2.70-3.20 and 4.40 - 5.20 (All 10 H, m), 6.25 - 8.10 (13 H, m).

{1172}

Working Example 2 11

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-2.20, 2.70-3.15, 3.20-3.60, 3.90-4.25 and 4.85 - 5.05 (All 13 H, m), 6.21 (0.6 H, dd, J=8.4Hz , J=2.2Hz), 6.50 (0.7 H, d, J=1.8Hz), 6.70 (0.9 H, d, J=8.4Hz), 6.80-7.40 (9.8 H, m).

{1173}

Working Example 2 14

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-4.60 {All 20 H, m, 2.33 (s) }, 5.15 and 5.21 (All 2 H, each s), 6.70 - 8.10 (12 H, m).

{1174}

Working Example 2 20

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-1.75 (1 H, m), 1.85 - 2.25 (3 H, m), 2.75 - 3.25 (3 H, m), 4.58 (2 H, d, J=5.6Hz), 4.9 - 5.1 (1 H, m), 6.3 - 6.5 (1 H, m), 6.58 (1 H, d, J=7.4Hz), 6.87 (1 H, t, J=7.6Hz), 7.06 (1 H, t, J=7.3Hz), 7.19 - 7.32 (8 H, m), 7.55(2 H, d, J=8.3Hz).

{1175}

Working Example 2 28

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-2.20, 2.30-3.35, 3.60-3.90 and 4.40 - 4.70 {All 14 H, m, 2.45 (s), 4.48 (s) }, 6.45 - 7.60 (12 H, m), 8.28 and 8.49(All 1 H, each s).

{1176}

Working Example 2 29

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.30-2.30, 2.70-3.90 and 4.40 - 4.60 (All 9 H, m), 4.62 and 4.64 (All 2 H, each s), 6.80 - 7.65(12.5 H, m), 8.48 and 8.75 (All 0.5 H, each s).

【1177】

実施例 230

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.30-2.20,2.70-3.10,3.20-4.00 及び 4.90-5.10(全 10H,m), 2.44 及び 2.48(全 3H,各 s), 4.48 及び 4.57(全 2H,各 s), 6.20-7.35(11H,m), 8.12 及び 8.30(全 1H,各 s)。

【1178】

実施例 231

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.20,2.65-3.85 及び 4.40-4.65(全 9H,m), 2.42(3H,s), 3.72 及び 3.77(全 3H,各 s), 4.43 及び 4.57(全 2H,各 s), 6.40-8.10(12.2H,m), 8.36 及び 8.64(全 0.8H,各 s)。

【1179】

実施例 232

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.2,2.2-3.3 5,3.65-3.75 及び 4.40-4.65(全 9H,m), 2.29 及び 2.33(全 3H,各 s), 2.42(3H,s), 4.44 及び 4.57(全 2H,各 s), 6.60-7.60(13.5H,m), 8.36 及び 8.62(全 0.5H,各 s)。

【1180】

実施例 233

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.20-2.20, 2.60-3.65 及び 4.20-4.40(全 9H,m), 2.31(3H,s), 5.10-5.16(全 2H,各 s), 6.46(0.1H,d,J=8.3Hz), 6.65(0.9H,d,J=8.3Hz), 6.82(0.9H,d,J=8.4Hz), 6.9 8-7.50(9.4H,m), 9.72,9.76 及び 9.90(全 0.7H,各 s)。

【1181】

実施例 234

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.20-1.65, 1.80-2.10,2.65-3.80 及び 4.20-4.40(全 9H,m), 5.11 及び 5.18(全 2H,各 s), 6.70-7.80(11.3H,m), 10.0 及び 10.2(全 0.7H,各 s)。

【1182】

実施例 235

{1177}

Working Example 2 30

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.30-2.20, 2.70-3.10, 3.20-4.00 and 4.90 - 5.10 (All 10 H, m), 2.44 and 2.48 (All 3 H, each s), 4.48 and 4.57(All 2 H, each s), 6.20 - 7.35 (11 H, m), 8.12 and 8.30 (All 1 H, each s).

{1178}

Working Example 2 31

compound

¹H-NHR (TRANSLATION STALLEDMHz , CDCl₃);de ppm :1.20-2.20, 2.65-3.85 and 4.40 - 4.65 (All 9 H, m), 2.42 (3 H, s), 3.72 and 3.77 (All 3 H, each s), 4.43and 4.57 (All 2 H, each s), 6.40 - 8.10 (12.2 H, m), 8.36 and 8.64 (All 0.8 H, each s).

{1179}

Working Example 2 32

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.2- 2.2, 2.2- 3.35, 3.65-3.75 and 4.40 - 4.65 (All 9 H, m), 2.29 and 2.33 (All 3 H, each s), 2.42 (3 H, s), 4.44and 4.57 (All 2 H, each s), 6.60 - 7.60 (13.5 H, m), 8.36 and 8.62 (All 0.5 H, each s).

{1180}

Working Example 2 33

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.20-2.20, 2.60-3.65 and 4.20 - 4.40 (All 9 H, m), 2.31 (3 H, s), 5.10 - 5.16 (All 2 H, each s), 6.46(0.1 H, d, J=8.3Hz), 6.65 (0.9 H, d, J=8.3Hz), 6.82 (0.9 H, d, J=8.4Hz), 6.98 - 7.50 (9.4 H, m), 9.72 and 9.76 and 9.90 (All 0.7 H, each s).

{1181}

Working Example 2 34

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.20-1.65, 1.80-2.10, 2.65-3.80 and 4.20 - 4.40 (All 9 H, m), 5.11 and 5.18 (All 2 H, each s), 6.70 - 7.80(11.3 H, m), 10.0 and 10.2 (All 0.7 H, each s).

{1182}

Working Example 2 35

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-3.85 及び 4.05-4.50[全 14H,m,2.18(s)],5.50-7.60(13.2H,m), 7.97 及び 8.32(全 0.8H,各 s)。

【1183】

実施例 237

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.82-4.26,4.29-4.62 及び 4.97-5.22(全 31H,m), 6.42-8.18(7H,m)。

【1184】

実施例 238

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-5.25(31H,m), 6.16-7.80(9H,m), 12.08-13.75(1H,m)。

【1185】

実施例 239

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.91-4.02,4.43-4.68 及び 5.04-5.23(全 22H,m), 2.31(3H,s), 6.50-7.74(11H,m)。

【1186】

実施例 240

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.51-4.75[全 28H,m,2.31(s), 3.90(s)],6.46-7.63(10H,m), 12.01-12.51(1H,m)。

【1187】

実施例 241

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.90-5.24(22H,m), 6.51-7.72(12H,m)。

【1188】

実施例 242

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-2.55(10H,m), 2.64-4.91[全 18H,m,3.86(s), 3.90(s)],6.79-7.63(10H,m), 12.42-12.83(1H,m)。

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-3.85 and 4.05 - 4.50 {All 14 H, m, 2.18 (s) }, 5.50 - 7.60 (13.2 H, m), 7.97 and 8.32(All 0.8 H, each s).

{1183}

Working Example 2 37

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.82-4.26, 4.29-4.62 and 4.97 - 5.22 (All 31 H, m), 6.42 - 8.18 (7 H, m).

{1184}

Working Example 2 38

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.08-5.25 (31 H, m), 6.16 - 7.80 (9 H, m), 12.08 - 13.75 (1 H, m).

{1185}

Working Example 2 39

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.91-4.02, 4.43-4.68 and 5.04 - 5.23 (All 22 H, m), 2.31 (3 H, s), 6.50 - 7.74 (11 H, m).

{1186}

Working Example 2 40

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.51-4.75 {All 28 H, m, 2.31 (s) , 3.90 (s) }, 6.46 - 7.63 (10 H, m), 12.01 - 12.51 (1 H, m).

{1187}

Working Example 2 41

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.90-5.24 (22 H, m), 6.51 - 7.72 (12 H, m).

{1188}

Working Example 2 42

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.17-2.55 (10 H, m), 2.64 - 4.91 {All 18 H, m, 3.86 (s) , 3.90 (s) }, 6.79 - 7.63 (10 H, m), 12.42 - 12.83(1 H, m).

【1189】

実施例 243

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.49-2.68(4H, m), 2.15(3H,s), 2.69-3.04 及び 4.44-5.21(全 2H, m), 3.66,3.76,3.80 及び 3.90(全 6H,各 s), 4.04-4.43(2H,m), 6.54-7.62(10H,m)。

【1190】

実施例 244

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.45-2.62[全 7 H,m,2.13(s)],2.71-3.06 及び 3.07-5.19[全 8H,m, 3.65(s)],6.00-7.65(11H,m)。

【1191】

実施例 245

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.00-5.22(25H, m), 6.45-7.82(11H,m), 12.52-13.54(1H,m)。

【1192】

実施例 246

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-2.55,2.56-4.42 及び 4.51-4.95[全 25H,m,3.95(s)],6.76-7.80 (11H,m), 12.40-12.98(1H,m)。

【1193】

実施例 247

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.21-5.12[全 2 8H,m,2.15(s), 2.30(s)],6.52-7.72(10H,m), 12.08 -13.78(1H,m)。

【1194】

実施例 248

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-5.28(22H, m), 2.36,3.45 及び 3.52(各 3H,s), 6.37-7.82(9H, m), 12.34-13.35(1H,m)。

【1195】

実施例 250

{1189}

Working Example 2 43

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.49-2.68 (4 H, m), 2.15 (3 H, s), 2.69 - 3.04 and 4.44 - 5.21 (All 2 H, m), 3. 66and 3. 76 and 3. 80 and 3.90 (All 6 H, each s), 4.04 - 4.43 (2 H, m), 6.54 - 7.62 (10 H, m).

{1190}

Working Example 2 44

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.45-2.62 {All 7 H, m, 2.13 (s) }, 2.71 - 3.06 and 3.07 - 5.19 {All 8 H, m, 3.65 (s) }, 6.00 - 7.65 (11 H, m).

{1191}

Working Example 2 45

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.00-5.22 (25 H, m), 6.45 - 7.82 (11 H, m), 12.52 - 13.54 (1 H, m).

{1192}

Working Example 2 46

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.14-2.55, 2.56-4.42 and 4.51 - 4.95 {All 25 H, m, 3.95 (s) }, 6.76 - 7.80 (11 H, m), 12.40 - 12.98(1 H, m).

{1193}

Working Example 2 47

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.21-5.12 {All 28 H, m, 2.15 (s), 2.30 (s) }, 6.52 - 7.72 (10 H, m), 12.08 - 13.78 (1 H, m).

{1194}

Working Example 2 48

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-5.28 (22 H, m), 2. 36 and 3. 45 and 3.52 (Each 3 H, s), 6.37 - 7.82 (9 H, m),12.34 - 13.35 (1 H, m).

{1195}

Working Example 2 50

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-4.29 及び 4.42-4.68[全 29H,m,2.14(s), 2.30(s)],6.47-7.62 (10H,m), 8.49-8.74(1H,m), 11.17-12.00(1H,m)。

【1196】

実施例 251

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-4.22,4.48-4.73 及び 4.92-5.19[全 32H,m,3.74(s), 3.85(s), 3.93(s)],6.70-7.50(10H,m), 11.62-12.22(1H,m)。

【1197】

実施例 252

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.09-2.51,2.62-4.29 及び 4.47-4.88[全 28H,m,2.43(s), 3.94(s)], 6.69-7.60(10H,m), 12.06-13.01(1H,m)。

【1198】

実施例 253

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-4.22,4.50-4.75 及び 4.91-5.10[全 32H,m,2.37(s), 2.42(s), 3.77(s)],6.70-7.60(10H,m), 11.60-12.50(1H,m)。

【1199】

実施例 254

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-2.62 及び 2.63-5.19[32H,m,2.15(s), 3.91(s)],6.51-7.68(10 H,m), 12.00-12.39(1H,m)。

【1200】

実施例 255

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.64-4.16 及び 4.44-4.68[全 20H,m,0.73(t,J=7.26Hz), 2.29(s), 2.55(s)],5.60-5.85 及び 6.48-7.50(全 11H,m)。

【1201】

実施例 260

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.14-4.29 and 4.42 - 4.68 {All 29 H, m, 2.14 (s) , 2.30 (s) } , 6.47 - 7.62 (10 H, m) , 8.49 - 8.74 (1 H, m) ,11.17 - 12.00 (1 H, m) .

{1196}

Working Example 2 51

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-4.22, 4.48-4.73 and 4.92 - 5.19 {All 32 H, m, 3.74 (s) , 3.85 (s) , 3.93 (s) } , 6.70 - 7.50 (10 H, m) , 11.62 - 12.22(1 H, m) .

{1197}

Working Example 2 52

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.09-2.51, 2.62-4.29 and 4.47 - 4.88 {All 28 H, m, 2.43 (s) , 3.94 (s) } , 6.69 - 7.60 (10 H, m) , 12.06 - 13.01(1 H, m) .

{1198}

Working Example 2 53

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.08-4.22, 4.50-4.75 and 4.91 - 5.10 {All 32 H, m, 2.37 (s) , 2.42 (s) , 3.77 (s) } , 6.70 - 7.60 (10 H, m) , 11.60 - 12.50(1 H, m) .

{1199}

Working Example 2 54

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05-2.62 and 2.63 - 5.19 {32 H, m, 2.15 (s) , 3.91 (s) } , 6.51 - 7.68 (10 H, m) , 12.00 - 12.39(1 H, m) .

{1200}

Working Example 2 55

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.64-4.16 and 4.44 - 4.68 {All 20 H, m, 0.73 (t, J=7.26Hz) , 2.29 (s) , 2.55 (s) } , 5.60 - 5.85 and 6.48 - 7.50 (All 11 H, m) .

{1201}

Working Example 2 60

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.62-1.40,1.41-2.19,2.20-4.13 及び 4.39-4.69[全 17H,m,0.73(t,J=7.25Hz), 2.57(s)],5.60-5.89 及び 6.31-7.73(全 12H,m)。

【1202】

実施例 262

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.38-1.82,1.83-2.35,2.40-2.58,2.65-3.78 及び 4.82-5.15[全 14H,m,2.12(s), 2.45(s)],6.60(1H,d,J=8.36Hz), 6.68-6.90 及び 6.97-7.48(全 9H,m)。

【1203】

実施例 263

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-2.24,2.37-2.60,2.64-3.92 及び 4.81-5.15[全 11H,m,2.48(s)],6.61(1H,d,J=8.38Hz), 6.71-6.92 及び 7.02-7.68(全 10H,m)。

【1204】

実施例 264

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-4.38,4.45-4.68 及び 4.95-5.18[全 32H,m,1.32(t), 2.12(s), 2.29(s), 2.50(s), 3.30(s)],6.40-7.68(10H,m), 11.48-12.38(1H,m)。

【1205】

実施例 265

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.74-4.08 及び 4.42-4.69[全 18H,m,2.29(s), 2.54(s)],5.59-5.80 及び 6.29-7.51(全 11H,m)。

【1206】

実施例 266

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-4.05,4.40-4.66,4.76-5.09,5.36-5.81 及び 6.30-7.68[全 25H,m,2.57(s), 4.96(brs), 6.45(brs)]。

【1207】

実施例 267

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.62-1.40, 1.41-2.19, 2.20-4.13 and 4.39 - 4.69 {All 17 H, m, 0.73 (t, J=7.25Hz), 2.57 (s) }, 5.60 - 5.89 and 6.31 - 7.73 (All 12 H, m).

{1202}

Working Example 2 62

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.38-1.82, 1.83-2.35, 2.40-2.58, 2.65-3.78 and 4.82 - 5.15 {All 14 H, m, 2.12 (s), 2.45 (s) }, 6.60 (1 H, d, J=8.36Hz), 6.68 - 6.90 and 6.97 -7.48 (All 9 H, m).

{1203}

Working Example 2 63

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-2.24, 2.37-2.60, 2.64-3.92 and 4.81 - 5.15 {All 11 H, m, 2.48 (s) }, 6.61 (1 H, d, J=8.38Hz), 6.71 - 6.92 and 7.02 -7.68 (All 10 H, m).

{1204}

Working Example 2 64

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-4.38, 4.45-4.68 and 4.95 - 5.18 {All 32 H, m, 1.32 (t), 2.12 (s), 2.29 (s), 2.50 (s), 3.30 (s) }, 6.40 - 7.68 (10 H, m), 11.48 - 12.38(1 H, m).

{1205}

Working Example 2 65

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.74-4.08 and 4.42 - 4.69 {All 18 H, m, 2.29 (s), 2.54 (s) }, 5.59 - 5.80 and 6.29 - 7.51 (All 11 H, m).

{1206}

Working Example 2 66

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.75-4.05, 4.40-4.66, 4.76-5.09, 5.36-5.81 and 6.30 - 7.68 {All 25 H, m, 2.57 (s), 4.96 (brs), 6.45 (brs) }.

{1207}

Working Example 2 67

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.76-2.60 及び 2.61-4.92[全 31H,m,2.08(s), 3.85(s)],6.30-7.50 (9H,m), 12.22-12.86(1H,m)。

【1208】

実施例 268

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.73-2.56 及び 2.57-4.94[全 31H,m,2.28(s), 2.39(s), 3.87(s)],6.52-7.52(9H,m), 12.17-13.00(1H,m)。

【1209】

実施例 269

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-4.08,4.41-4.68,4.82-5.09,5.37-5.96 及び 6.30-7.58[全 27H, m,2.29(s), 2.54(s), 5.00(brs), 6.45(brs)]。

【1210】

実施例 270

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-4.29,4.41-4.68 及び 4.96-5.15[全 29H,m,2.53(s), 3.31(s)], 6.38-7.72(11H,m), 11.64-12.47(1H,m)。

【1211】

実施例 271

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.80-4.98[23H, m,2.52(s), 2.58(d,J=4.4Hz)],6.47-7.72(11H,m), 12.56-13.30(1H,m)。

【1212】

実施例 272

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.58-4.00,4.12-4.68 及び 5.06-5.24[全 14H,m,1.63(s)],5.45-5.82 及び 6.49-8.09(全 17H,m)。

【1213】

実施例 273

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-5.20[全 20H,m,2.85(s)],6.48-6.72,6.81-7.08 及び 7.09-7.7

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.76-2.60 and 2.61 - 4.92 {All 31 H, m, 2.08 (s) , 3.85 (s) } , 6.30 - 7.50 (9 H, m) , 12.22 - 12.86(1 H, m) .

{1208}

Working Example 2 68

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.73-2.56 and 2.57 - 4.94 {All 31 H, m, 2.28 (s) , 2.39 (s) , 3.87 (s) } , 6.52 - 7.52 (9 H, m) , 12.17 - 13.00(1 H, m) .

{1209}

Working Example 2 69

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.14-4.08, 4.41-4.68, 4.82-5.09, 5.37-5.96 and 6.30 - 7.58 {All 27 H, m, 2.29 (s) , 2.54 (s) , 5.00 (brs) , 6.45 (brs) } .

{1210}

Working Example 2 70

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-4.29, 4.41-4.68 and 4.96 - 5.15 {All 29 H, m, 2.53 (s) , 3.31 (s) } , 6.38 - 7.72 (11 H, m) , 11.64 - 12.47(1 H, m) .

{1211}

Working Example 2 71

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.80-4.98 {23 H, m, 2.52 (s) , 2.58 (d, J=4.4Hz) } , 6.47 - 7.72 (11 H, m) , 12.56 - 13.30 (1 H, m) .

{1212}

Working Example 2 72

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.58-4.00, 4.12-4.68 and 5.06 - 5.24 {All 14 H, m, 1.63 (s) } , 5.45 - 5.82 and 6.49 - 8.09 (All 17 H, m) .

{1213}

Working Example 2 73

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.08-5.20 {All 20 H, m, 2.85 (s) } , 6.48 - 6.72 and 6.

9[全 16H,m,6.74(d,J=8.2Hz)],12.62-13.78(1H,m)。

【1214】

実施例 274

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.04-5.24(22H,m), 6.38-6.71 及び 6.72-7.60(全 16H,m), 12.49-13.31(1H,m)。

【1215】

実施例 275

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-5.19[20H,m,1.74(s)],6.41-6.68 及び 6.79-7.60(全 16H,m)。

【1216】

実施例 276

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.78-2.34,2.35-4.48,4.49-4.74 及び 4.92-5.12[全 35H,m,1.39(t,d,J=7.0Hz), 1.83(s), 3.90(s), 3.93(s), 3.95(s), 3.98(s)],6.70-7.60(9H,m), 11.61-12.24(1H,m)。

【1217】

実施例 277

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-2.28,2.29-4.33,4.50-4.76 及び 4.91-5.13[全 32H,m,1.85(s), 2.39(s), 2.45(s), 3.30(s), 3.77(s), 3.99(s)],6.70-7.58(10H,m), 11.58-12.27(1H,m)。

【1218】

実施例 278

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-4.29 及び 4.42-4.93[全 26H,m,1.41(t,J=7.3Hz), 2.53(s), 3.87(s)],6.58-7.68(11H,m), 12.52-13.50(1H,m)。

【1219】

実施例 279

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.48-1.41,1.49-2.88,2.94-3.28,3.32-4.80 及び 5.31-5.62[全 22H,m,0.52(d,J=6.5Hz), 0.96(d,J=6.5Hz), 2.58(s), 3.

81 - 7.08 and 7.09 - 7.79{All 16 H, m, 6.74 (d, J=8.2Hz) }, 12.62 - 13.78 (1 H, m).

{1214}

Working Example 2 74

compound

¹H-NHR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.04-5.24 (22 H, m), 6.38 - 6.71 and 6.72 - 7.60 (All 16 H, m), 12.49 - 13.31(1 H, m).

{1215}

Working Example 2 75

compound

¹H-NHR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-5.19 {20 H, m, 1.74 (s) }, 6.41 - 6.68 and 6.79 - 7.60 (All 16 H, m).

{1216}

Working Example 2 76

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.78-2.34, 2.35-4.48, 4.49-4.74 and 4.92 - 5.12 {All 35 H, m, 1.39 (t, d, J=7.0Hz) , 1.83 (s) , 3.90 (s) , 3.93 (s) , 3.95 (s) , 3.98 (s) }, 6.70 - 7.60 (9 H, m), 11.61 - 12.24(1 H, m).

{1217}

Working Example 2 77

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.75-2.28, 2.29-4.33, 4.50-4.76 and 4.91 - 5.13 {All 32 H, m, 1.85 (s) , 2.39 (s) , 2.45 (s) , 3.30 (s) , 3.77 (s) , 3.99 (s) }, 6.70 - 7.58 (10 H, m), 11.58 - 12.27(1 H, m).

{1218}

Working Example 2 78

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.12-4.29 and 4.42 - 4.93 {All 26 H, m, 1.41 (t, J=7.3Hz) , 2.53 (s) , 3.87 (s) }, 6.58 - 7.68 (11 H, m), 12.52 - 13.50(1 H, m).

{1219}

Working Example 2 79

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.48-1.41, 1.49-2.88, 2.94-3.28, 3.32-4.80 and 5.31 - 5.62 {All 22 H, m, 0.52 (d, J=6.5Hz) , 0.96 (d, J=6.5Hz) ,

87(s)],6.37-6.79 及び 6.80-7.75(全 12H,m)。

【1220】

実施例 283

の化合物

 $^1\text{H-NMR}$ (250MHz,CDCl₃) δ ppm

1.10-2.96,2.97-3.91,4.05-4.61 及び 5.05-5.19[全 20H,m,1.63(s), 2.87(d,J=4.5Hz)],5.49-5.78,6.07-6.32,6.46-6.69 及び 6.81-7.62(全 9H,m)。

【1221】

実施例 284

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz,CDCl₃) δ ppm:0.79-4.32,4.33-4.66 及び 4.99-5.26[全 34H,m,1.41(t,J=5.8Hz), 3.31(s)],6.02-6.37,6.45-6.68 及び 6.78-7.81(全 8 H,m), 11.83-12.39(1H,m)。

【1222】

実施例 285

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-3.40,3.52-4.10,4.11-4.62 及び 5.04-5.23[全 36H,m,1.41(t,J=7.18Hz), 3.31(s)],6.05(1H,t,J=6.68Hz), 6.51-6.69 及び 6.82-7.68(7H,m), 11.99-12.39(1H,m)。

【1223】

実施例 286

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.35-0.65,0.80-2.12,2.13-2.88,2.89-3.23,3.32-4.24,4.34-4.65,5.26-5.47 及び 6.31-7.44[全 38H,m,0.50(d,J=6.5Hz), 0.94(d,J=6.5Hz), 2.49(s)]。

【1224】

実施例 287

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.50-0.81,1.00-2.13,2.14-3.17,3.21-4.00,4.36-4.62,5.48-5.71 及び 6.39-7.43[全 38H,m,0.65(t,J=7.3Hz), 2.49(s)]。

【1225】

実施例 288

2.58 (s), 3.87 (s) }, 6.37 - 6.79 and 6.80 - 7.75 (All 12 H, m).

{1220}

Working Example 2 83

compound

$^1\text{H-NMR}$ (250 MHz, CDCl₃); δ ppm

1.10 - 2.96 and 2.97 - 3.91 and 4.05 - 4.61 and 5.05 - 5.19 {All 20 H, m, 1.63 (s), 2.87 (d, J=4.5Hz) }, 5.49 - 5.78 and 6.07 - 6.32 and 6.46 - 6.69 and 6.81 - 7.62 (All 9 H, m).

{1221}

Working Example 2 84

compound

$^1\text{H-NMR}$ (250 MHz, CDCl₃); δ ppm :0.79-4.32, 4.33-4.66 and 4.99 - 5.26 {All 34 H, m, 1.41 (t, J=5.8Hz), 3.31 (s) }, 6.02 - 6.37 and 6.45 - 6.68 and 6.78 - 7.81 (All 8 H, m), 11.83 - 12.39 (1 H, m).

{1222}

Working Example 2 85

compound

$^1\text{H-NMR}$ (250 MHz, CDCl₃); δ ppm :1.17-3.40, 3.52-4.10, 4.11-4.62 and 5.04 - 5.23 {All 36 H, m, 1.41 (t, J=7.18Hz), 3.31 (s) }, 6.05 (1 H, t, J=6.68Hz), 6.51 - 6.69 and 6.82 - 7.68 (7 H, m), 11.99 - 12.39 (1 H, m).

{1223}

Working Example 2 86

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl₃); δ ppm :0.35-0.65, 0.80-2.12, 2.13-2.88, 2.89-3.23, 3.32-4.24, 4.34-4.65, 5.26-5.47 and 6.31 - 7.44 {All 38 H, m, 0.50 (d, J=6.5Hz), 0.94 (d, J=6.5Hz), 2.49 (s) }.

{1224}

Working Example 2 87

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl₃); δ ppm :0.50-0.81, 1.00-2.13, 2.14-3.17, 3.21-4.00, 4.36-4.62, 5.48-5.71 and 6.39 - 7.43 {All 38 H, m, 0.65 (t, J=7.3Hz), 2.49 (s) }.

{1225}

Working Example 2 88

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.81-2.55(5H, m), 2.31(3H,s), 2.56-3.97,4.31-4.70 及び 5.08-5.50(全 4H,m), 6.50-7.83(12H,m)。

【1226】

実施例 289

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.49[全 8 H,m,1.95(s)],2.59-3.94,4.00-4.25,4.40-4.67 及び 5.09-5.29[全 13H,m,3.47(s), 3.55(s), 3.68(s)],6.30-7.48(9H,m)。

【1227】

実施例 291

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.27(5H, m), 2.52-4.33,4.51-4.73 及び 5.00-5.19[全 13H, m,3.70(s), 3.74(s), 3.75(s)],6.71-7.54(10H,m)。

【1228】

実施例 292

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.27-2.42(5H, m), 2.36(3H,s), 2.58-3.07(2H,m), 3.10-4.31,4.38-4.67 及び 5.19-5.29[全 11H,m,3.53(s), 3.68(s)],6.41-7.48(9H,m)。

【1229】

実施例 293

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.09-2.42(5H, m), 2.58-4.24,4.49-4.74 及び 5.01-5.22(全 10H, m), 5.24-7.56(11H,m)。

【1230】

実施例 294

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.58(4H, m), 2.35(3H,s), 2.60-4.09,4.36-4.68 及び 5.02-5.30(全 5H,m), 3.49(6H,s), 6.31-7.49(10H,m)。

【1231】

実施例 295

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.81-2.55 (5 H, m), 2.31 (3 H, s), 2.56 - 3.97 and 4.31 - 4.70 and 5.08 - 5.50 (All 4 H, m), 6.50 - 7.83 (12 H, m).

{1226}

Working Example 289

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.15-2.49 {All 8 H, m, 1.95 (s) }, 2.59 - 3.94 and 4.00 - 4.25 and 4.40 - 4.67 and 5.09 - 5.29 {All 13 H, m, 3.47 (s), 3.55 (s), 3.68 (s) }, 6.30 - 7.48 (9 H, m).

{1227}

Working Example 291

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.15-2.27 (5 H, m), 2.52 - 4.33 and 4.51 - 4.73 and 5.00 - 5.19 {All 13 H, m, 3.70 (s), 3.74 (s), 3.75 (s) }, 6.71 - 7.54 (10 H, m).

{1228}

Working Example 292

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.27-2.42 (5 H, m), 2.36 (3 H, s), 2.58 - 3.07 (2 H, m), 3.10 - 4.31 and 4.38 - 4.67 and 5.19 - 5.29 {All 11 H, m, 3.53 (s), 3.68 (s) }, 6.41 - 7.48 (9 H, m).

{1229}

Working Example 293

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.09-2.42 (5 H, m), 2.58 - 4.24 and 4.49 - 4.74 and 5.01 - 5.22 (All 10 H, m), 5.24 - 7.56 (11 H, m).

{1230}

Working Example 294

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.18-2.58 (4 H, m), 2.35 (3 H, s), 2.60 - 4.09 and 4.36 - 4.68 and 5.02 - 5.30 (All 5 H, m), 3.49 (6 H, s), 6.31 - 7.49 (10 H, m).

{1231}

Working Example 295

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-2.47(4H, m), 2.58-3.40,3.41-4.38,4.39-4.68 及び 5.09-5.30 (全 11H,m), 3.67 及び 3.71(各 3H,各 s), 6.55-7.83(11H,m)。

【1232】

実施例 296

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-2.39(4H, m), 2.51-3.95,4.36-4.64 及び 5.05-5.31[全 8H,m, 3.65(s)],6.50-7.80(11H,m), 8.99-10.36(1H,m)。

【1233】

実施例 297

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.34,2.58-3.30,3.31-4.37,4.51-4.72 及び 5.01-5.19[全 15H, m,3.76(s)],6.71-7.69(11H,m)。

【1234】

実施例 298

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.29(4H, m), 2.57-3.21,3.30-4.13,4.49-4.72 及び 4.99-5.21 [全 8H,m,3.73(s)],5.41-7.69(12H,m)。

【1235】

実施例 299

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.22,2.24-2.52,2.57-3.19,3.28-4.41,4.51-4.73 及び 4.99-5.20[全 18H,m,2.37(s), 3.76(s)],6.71-7.58(10H, m)。

【1236】

実施例 300

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.07-4.14 及び 4.15-5.58[全 16H,m,2.35(s), 3.73(s)],6.62-7.64 (10H,m)。

【1237】

実施例 301

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-2.47 (4 H, m), 2.58 - 3. 40 and 3. 41 - 4. 38 and 4. 39 -4.68 and 5.09 - 5.30 (All 11 H, m), 3.67 and 3.71 (Each 3 H, each s), 6.55 - 7.83 (11 H, m).

{1232}

Working Example 2 96

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-2.39 (4 H, m), 2.51 - 3. 95 and 4. 36 - 4.64 and 5.05 - 5.31 {All 8 H, m, 3.65 (s) }, 6.50 - 7.80 (11 H, m), 8.99 - 10.36 (1 H, m).

{1233}

Working Example 2 97

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-2.34, 2.58-3.30, 3.31 -4.37, 4.51-4.72 and 5.01 - 5.19 {All 15 H, m, 3.76 (s) }, 6.71 - 7.69 (11 H, m).

{1234}

Working Example 2 98

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.29 (4 H, m), 2.57 - 3. 21 and 3. 30 - 4. 13 and 4. 49 -4.72 and 4.99 - 5.21 {All 8 H, m, 3.73 (s) }, 5.41 - 7.69 (12 H, m).

{1235}

Working Example 2 99

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.12-2.22, 2.24-2.52, 2.57-3.19, 3.28-4.41, 4.51-4.73 and 4.99 - 5.20 {All 18 H, m, 2.37 (s) , 3.76 (s) }, 6.71 - 7.58 (10 H, m).

{1236}

Working Example 300

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.07-4.14 and 4.15 - 5.58 {All 16 H, m, 2.35 (s) , 3.73 (s) }, 6.62 - 7.64 (10 H, m).

{1237}

Working Example 301

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.31[全 10H,m,1.90(s)],2.54-3.23,3.33-3.97,4.05-4.31,4.51-4.71 及び 5.01-5.18[全 11H,m,3.74(s)],6.31-7.50(9H,m)。

【1238】

実施例 302

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-2.22(4H, m), 2.57-3.20,3.36-4.35,4.50-4.71 及び 5.02-5.20 [全 17H,m,3.76(s), 3.91(s), 3.93(s)],6.71-7.55(9 H,m)。

【1239】

実施例 303

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-2.51[全 7 H,m,2.39(s)],2.57-3.21,3.22-4.35,4.51-4.73 及び 5.01-5.19[全 11H,m,3.76(s)],6.70-7.55(10H,m)。

【1240】

実施例 304

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.49[全 10H,m,2.11(s), 2.34(s)],2.56-3.22,3.30-4.32,4.49-4.73 及び 5.02-5.19[全 11H,m,3.67(s), 3.74(s)], 6.48-7.52(9H,m)。

【1241】

実施例 307

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.09-2.25(4H, m), 2.37 及び 2.44(全 3H,各 s), 2.55-3.30,3.31-4.22 及び 4.49-6.21[全 9H,m,3.73(s)],6.70-7.58 (10H,m)。

【1242】

実施例 309

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-4.23,4.42-4.69 及び 5.03-5.25[全 18H,m,2.13(s), 2.48(s), 3.71(s)],6.30-7.54(10H,m)。

【1243】

実施例 310

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.13-2.31 {All 10 H, m, 1.90 (s) }, 2.54 - 3. 23 and 3. 33 - 3. 97 and 4. 05 -4. 31 and 4. 51 - 4.71 and 5.01 - 5.18 {All 11 H, m, 3.74 (s) }, 6.31 - 7.50 (9 H, m).

{1238}

Working Example 302

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.14-2.22 (4 H, m), 2.57 - 3. 20 and 3. 36 - 4. 35 and 4. 50 -4.71 and 5.02 - 5.20 {All 17 H, m, 3.76 (s) }, 3.91 (s) }, 3.93 (s) }, 6.71 - 7.55 (9 H, m).

{1239}

Working Example 303

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.11-2.51 {All 7 H, m, 2.39 (s) }, 2.57 - 3. 21 and 3. 22 - 4. 35 and 4. 51 -4.73 and 5.01 - 5.19 {All 11 H, m, 3.76 (s) }, 6.70 - 7.55 (10 H, m).

{1240}

Working Example 304

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.49 {All 10 H, m, 2.11 (s) }, 2.34 (s) }, 2.56 - 3. 22 and 3. 30 - 4. 32 and 4. 49 -4.73 and 5.02 - 5.19 {All 11 H, m, 3.67 (s) }, 3.74 (s) }, 6.48 - 7.52 (9 H, m).

{1241}

Working Example 307

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.09-2.25 (4 H, m), 2.37 and 2.44 (All 3 H, each s), 2.55 - 3. 30 and 3. 31 -4.22 and 4.49 - 6.21 {All 9 H, m, 3.73 (s) }, 6.70 - 7.58 (10 H, m).

{1242}

Working Example 309

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.14-4.23, 4.42-4.69 and 5.03 - 5.25 {All 18 H, m, 2.13 (s) }, 2.48 (s) }, 3.71 (s) }, 6.30 - 7.54 (10 H, m).

{1243}

Working Example 310

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-2.29(4H, m), 2.39-4.32,4.43-4.65 及び 5.02-5.22[全 11H, m,2.51(s), 3.74(s)],6.41-7.69(11H,m)。

【1244】

実施例 311

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-3.99,4.38-4.65 及び 5.01-5.22[全 15H,m,2.12(s), 2.47(s)], 6.40-7.48(10H,m)。

【1245】

実施例 312

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.34(4H, m), 2.35-4.09,4.40-4.68 及び 5.03-5.25[全 8H,m, 2.50(s)],6.40-7.70(11H,m)。

【1246】

実施例 313

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-2.52,2.53-3.94,3.97-4.32,4.37-4.62 及び 5.07-5.28[全 20H, m,3.74(s)],6.00-6.32,6.40-6.68,6.70-7.01 及び 7.02-7.40(全 8H,m)。

【1247】

実施例 314

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-2.37,2.38-3.92,4.01-4.64 及び 5.08-5.28[全 22H,m,3.74(s)],6.07(1H,t,J=6.7Hz), 6.41-6.71 及び 6.72-7.41(全 7H,m)。

【1248】

実施例 315

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.31,2.48-3.32,3.37-3.82,3.83-4.36,4.37-4.58 及び 5.10-5.25[全 12H,m,1.58(s), 3.59(s)],6.43-6.66 及び 6.79-7.52(全 16H,m)。

【1249】

実施例 316

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.17-2.29 (4 H, m), 2.39 - 4. 32 and 4. 43 - 4.65 and 5.02 - 5.22 {All 11 H, m, 2.51 (s), 3.74 (s) }, 6.41 - 7.69 (11 H, m).

{1244}

Working Example 311

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05-3.99, 4.38-4.65 and 5.01 - 5.22 {All 15 H, m, 2.12 (s), 2.47 (s) }, 6.40 - 7.48 (10 H, m).

{1245}

Working Example 312

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.12-2.34 (4 H, m), 2.35 - 4. 09 and 4. 40 - 4.68 and 5.03 - 5.25 {All 8 H, m, 2.50 (s) }, 6.40 - 7.70 (11 H, m).

{1246}

Working Example 313

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-2.52, 2.53-3.94, 3.97-4.32, 4.37-4.62 and 5.07 - 5.28 {All 20 H, m, 3.74 (s) }, 6.00 - 6. 32 and 6. 40 - 6.68 and 6. 70 - 7.01 and 7.02 - 7.40 (All 8 H, m).

{1247}

Working Example 314

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.08-2.37, 2.38-3.92, 4.01-4.64 and 5.08 - 5.28 {All 22 H, m, 3.74 (s) }, 6.07 (1 H, t, J=6.7Hz), 6.41 - 6.71 and 6.72 -7.41 (All 7 H, m).

{1248}

Working Example 315

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.12-2.31 , 2.48-3.32, 3.37-3.82, 3.83-4.36, 4.37-4.58 and 5.10 - 5.25 {All 12 H, m, 1.58 (s), 3.59 (s) }, 6.43 - 6.66 and 6.79 - 7.52 (All 16 H, m).

{1249}

Working Example 316

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.22-3.06,3.07-3.25,3.32-3.79,4.38-4.60 及び 5.08-5.24[全 9H, m,3.48(s), 3.58(s)],6.42-6.63 及び 6.78-8.51(全 17H,m)。

【1250】

実施例 317

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.52,2.53-3.33,3.34-3.88,3.89-4.65,5.08-5.25(全 17H,m), 5.99-6.36,6.44-6.70 及び 6.78-7.55(全 9H,m)。

【1251】

実施例 318

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-3.32,3.33-4.62 及び 5.08-5.26(全 19H,m), 6.05(1H,t,J=6.7 Hz), 6.48-6.74 及び 6.75-7.81(全 8H,m)。

【1252】

実施例 319

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-2.30,2.57-3.90,3.91-4.67 及び 5.12-5.31[全 12H,m,1.59(s), 3.75(s)],6.49-6.74 及び 6.81-7.87(全 16H,m)。

【1253】

実施例 320

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.26(4H, m), 2.55-3.36,3.37-3.90,4.38-4.62 及び 5.10-5.30 (全 5H,m), 6.50-6.71 及び 6.82-7.81(全 17H,m)。

【1254】

実施例 321

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.39,2.40-4.27,4.46-4.68 及び 5.06-5.22[全 18H,m,2.52(s), 3.72(s), 3.82(s)及び 3.87(s)],6.48-7.68(11H, m)。

【1255】

実施例 322

compound

¹H-NHR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.22-3.06, 3.07-3.25, 3.32-3.79, 4.38-4.60 and 5.08 - 5.24 {All 9 H, m, 3.48 (s) , 3.58 (s) } , 6.42 - 6.63 and 6.78 - 8.51 (All 17 H, m) .

{1250}

Working Example 317

compound

¹H-NHR.(250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.12-2.52, 2.53-3.33, 3.34-3.88, 3.89-4.65, 5.08-5.25 (All 17 H, m) , 5.99 - 6. 36 and 6. 44 - 6.70 and 6.78 - 7.55(All 9 H, m) .

{1251}

Working Example 318

compound

¹H-NHR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-3.32, 3.33-4.62 and 5.08 - 5.26 (All 19 H, m) , 6.05 (1 H, t, J=6.7Hz) , 6.48 - 6.74 and 6.75 -7.81 (All 8 H, m) .

{1252}

Working Example 319

compound

¹H-NHR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-2.30, 2.57-3.90, 3.91-4.67 and 5.12 - 5.31 {All 12 H, m, 1.59 (s) , 3.75 (s) } , 6.49 - 6.74 and 6.81 - 7.87 (All 16 H, m) .

{1253}

Working Example 320

compound

¹H-NHR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-2.26 (4 H, m) , 2.55 - 3. 36 and 3. 37 - 3. 90 and 4. 38 -4.62 and 5.10 - 5.30 (All 5 H, m) , 6.50 - 6.71 and 6.82 - 7.81 (All 17 H, m) .

{1254}

Working Example 321

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-2.39, 2.40-4.27, 4.46-4.68 and 5.06 - 5.22 {All 18 H, m, 2.52 (s) , 3.72 (s) , 3.82 (s) and 3.87 (s) } , 6.48 - 7.68 (11 H, m) .

{1255}

Working Example 322

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.86-4.31,4.43-4.67 及び 5.03-5.20[全 26H,m,2.43(s), 2.47(s), 3.72(s)],6.41-7.46(7H,m)。

【1256】

実施例 323

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.07-4.31,4.40-4.67 及び 5.02-5.20[全 28H,m,2.43(s), 2.47(s), 3.72(s)],6.40-7.46(7H,m)。

【1257】

実施例 324

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-4.31,4.43-4.65 及び 5.02-5.20[全 24H,m,2.43(s), 2.48(s), 3.71(s)],6.44-7.48(7H,m)。

【1258】

実施例 325

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.98-5.26[24H, m,2.43(s), 2.48(s)],6.42-7.53[7H,m,6.64(d,J=7.3 Hz)]。

【1259】

実施例 326

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03-4.04,4.42-4.64 及び 5.01-5.21[全 25H,m,2.43(s), 2.48(s)], 6.41-7.45(7H,m)。

【1260】

実施例 327

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.04-4.01,4.40-4.66 及び 5.02-5.22[全 21H,m,2.43(s), 2.48(s)], 6.43-7.48(7H,m)。

【1261】

実施例 328

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-2.28,2.38-4.02,4.41-4.68 及び 5.02-5.22[全 15H,m,2.51(s), 2.56(s), 3.78(s)],6.48-7.62(11H,m)。

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.86-4.31 , 4.43-4.67 and 5.03 - 5.20 {All 26 H, m, 2.43 (s) , 2.47 (s) , 3.72 (s) } , 6.41 - 7.46 (7 H, m) .

{1256}

Working Example 323

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.07-4.31 , 4.40-4.67 and 5.02 - 5.20 {All 28 H, m, 2.43 (s) , 2.47 (s) , 3.72 (s) } , 6.40 - 7.46 (7 H, m) .

{1257}

Working Example 324

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-4.31 , 4.43-4.65 and 5.02 - 5.20 {All 24 H, m, 2.43 (s) , 2.48 (s) , 3.71 (s) } , 6.44 - 7.48 (7 H, m) .

{1258}

Working Example 325

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.98-5.26 [24 H, m, 2.43 (s) , 2.48 (s)] , 6.42 - 7.53 [7 H, m, 6.64 (d, J=7.3Hz)] .

{1259}

Working Example 326

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.03-4.04, 4.42-4.64 and 5.01 - 5.21 {All 25 H, m, 2.43 (s) , 2.48 (s) } , 6.41 - 7.45 (7 H, m) .

{1260}

Working Example 327

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.04-4.01, 4.40-4.66 and 5.02 - 5.22 {All 21 H, m, 2.43 (s) , 2.48 (s) } , 6.43 - 7.48 (7 H, m) .

{1261}

Working Example 328

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.14-2.28, 2.38-4.02, 4.41-4.68 and 5.02 - 5.22 {All 15 H, m, 2.51 (s) , 2.56 (s) , 3.78 (s) } , 6.48 - 7.62 (11 H, m) .

【1262】

実施例 329

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.32(4H, m), 2.43-4.32,4.45-4.68 及び 5.03-5.22[全 11H, m,2.55(s), 2.58(s), 3.73(s)],6.43-7.80(16H,m)。

【1263】

実施例 332

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.54-1.04,1.05-2.25,2.26-4.18,4.36-4.74 及び 5.52-5.84[全 17H, m,0.67(t,J=7.3Hz), 2.60(s)],6.38-7.82(17H,m)。

【1264】

実施例 333

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.9-4.2,4.4-4.6 5 及び 5.0-5.25(全 22H,m), 6.45-6.67 及び 6.78-7.88[全 13H,m,6.58(d,J=8.3Hz)]。

【1265】

実施例 334

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.9-4.1,4.45-4.65 及び 5.0-5.2[全 22H,m,1.23(t,J=7.1Hz)],6.35-7.55(13H,m)。

【1266】

実施例 335

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.06(3H,t,J=7.2 Hz), 1.1-1.55(5H,m), 1.6-2.0(5H,m), 2.2-2.7(9 H,m), 3.4-3.9(7H,m), 4.55-4.85(1H,m), 6.19(1 H,t,J=5.5Hz), 6.62(1H,d,J=8.2Hz), 6.8-7.1(1H, m), 6.99(2H,d,J=7.9Hz), 7.16(2H,d,J=7.9Hz), 7.33(1H,d,J=2.4Hz)。

【1267】

実施例 336

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05(3H,t,J=7.2 Hz), 2.2-2.7(8H,m), 3.4-3.9(7H,m), 4.6-4.9(1H, m), 6.21(1H,t,J=5.8Hz), 6.65(1H,d,J=8.3Hz), 6.

{1262}

Working Example 329

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.32 (4 H, m), 2.43 - 4. 32 and 4. 45 - 4.68 and 5.03 - 5.22 {All 11 H, m, 2.55 (s), 2.58 (s), 3.73 (s) }, 6.43 - 7.80 (16 H, m).

{1263}

Working Example 332

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.54-1.04, 1.05-2.25, 2.26-4.18, 4.36-4.74 and 5.52 - 5.84 {All 17 H, m, 0.67 (t, J=7.3Hz), 2.60 (s) }, 6.38 - 7.82 (17 H, m).

{1264}

Working Example 333

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.9-4.2, 4.4- 4.65 and 5.0 - 5.25 (All 22 H, m), 6.45 - 6.67 and 6.78 - 7.88 {All 13 H, m, 6.58 (d, J=8.3Hz) }.

{1265}

Working Example 334

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.9-4.1, 4.45-4.65 and 5.0 - 5.2 {All 22 H, m, 1.23 (t, J=7.1Hz) }, 6.35 - 7.55 (13 H, m).

{1266}

Working Example 335

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.06 (3 H, t, J=7.2Hz), 1.1 - 1.55 (5 H, m), 1.6 - 2.0 (5 H, m), 2.2 - 2.7 (9 H, m), 3.4- 3.9 (7 H, m), 4.55 - 4.85 (1 H, m), 6.19 (1 H, t, J=5.5Hz), 6.62 (1 H, d, J=8.2Hz), 6.8 - 7.1 (1 H, m), 6.99 (2 H, d, J=7.9Hz),7.16 (2 H, d, J=7.9Hz), 7.33 (1 H, d, J=2.4Hz).

{1267}

Working Example 336

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05 (3 H, t, J=7.2Hz), 2.2 - 2.7 (8 H, m), 3.4 - 3.9 (7 H, m), 4.6 - 4.9 (1 H, m), 6.21(1 H, t, J=5.8Hz), 6.65 (1 H,

8-7.1(1H,m), 7.2-7.6(10H,m)。

【1268】

実施例 337

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.99 及び 1.21 (全 6H,各 t,J=7Hz), 2.0-2.8(7H,m), 3.0-4.9(7H,m), 6.34(1H,t,J=5.5Hz), 6.65(1H,d,J=8.1Hz), 6.75-7.8(12H,m)。

【1269】

実施例 339

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-4.2,4.4-4.7 及び 5.0-5.2(全 19H,m), 6.5-6.7[1H,m,6.63(d,J=7.1Hz)],6.8-7.8(12H,m), 8.2-8.7(1H,m)。

【1270】

実施例 340

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃+DMSO-d₆) δ ppm:1.0-4.8 及び 5.0-5.2[全 24H,m,1.47(t,J=7.1Hz)],6.5-8.0(13H,m), 8.9-9.8(1H,m), 11.6-12.5(1H,m)。

【1271】

実施例 341

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-2.3,2.4-4.7 及び 4.9-5.15(全 21H,m), 6.58(1H,d,J=7.7Hz), 6.7-7.8(12H,m), 8.35-8.8(1H,m)。

【1272】

実施例 342

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.9-4.0,4.4-4.7 及び 5.0-5.25(全 21H,m), 6.5-6.7(1H,m), 6.8-7.7(12H,m), 8.2-8.5(1H,m)。

【1273】

実施例 344

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.9-4.1,4.4-4.7 及び 4.9-5.15[全 27H,m,1.12(t,J=5.7Hz), 2.49(s), 4.52(s)],6.4-7.7[12H,m,6.62(d,J=6.1Hz)],8.

d, J=8.3Hz), 6.8 - 7.1 (1 H, m), 7.2 - 7.6 (10 H, m)。

{1268}

Working Example 337

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.99 and 1.21 (All 6 H, each t, J=7Hz), 2.0 - 2.8 (7 H, m), 3.0 - 4.9 (7 H, m), 6.34 (1 H, t, J=5.5Hz), 6.65 (1 H, d, J=8.1Hz), 6.75 - 7.8 (12 H, m)。

{1269}

Working Example 339

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.2- 4.2, 4.4- 4.7 and 5.0 - 5.2 (All 19 H, m), 6.5 - 6.7 {1 H, m, 6.63 (d, J=7.1Hz)}, 6.8 - 7.8 (12 H, m), 8.2 - 8.7 (1 H, m)。

{1270}

Working Example 340

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃+DMSO-d₆); de ppm :1.0-4.8 and 5.0 - 5.2 {All 24 H, m, 1.47 (t, J=7.1Hz)}, 6.5 - 8.0 (13 H, m), 8.9 - 9.8 (1 H, m), 11.6- 12.5 (1 H, m)。

{1271}

Working Example 341

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.1- 2.3, 2.4- 4.7 and 4.9 - 5.15 (All 21 H, m), 6.58 (1 H, d, J=7.7Hz), 6.7 - 7.8 (12 H, m), 8.35 - 8.8 (1 H, m)。

{1272}

Working Example 342

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.9-4.0, 4.4- 4.7 and 5.0 - 5.25 (All 21 H, m), 6.5 - 6.7 (1 H, m), 6.8 - 7.7 (12 H, m), 8.2- 8.5 (1 H, m)。

{1273}

Working Example 344

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.9-4.1, 4.4- 4.7 and 4.9 - 5.15 {All 27 H, m, 1.12 (t, J=5.7Hz), 2.49 (s), 4.52 (s)}, 6.4 - 7.7 {12 H, m, 6.62 (d,

1-8.5[1H,m,8.15(s), 8.41(s)]。

【1274】

実施例 345

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:0.9-4.1,4.3-4.8 及び 4.9-5.1(全 24H,m), 6.7-8.0(11H,m), 8.3-8.8[1H,m,8.38(s), 8.67(s)]。

【1275】

実施例 346

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.0-5.1[24H, m,2.46(s), 2.47(s), 4.48(s), 4.61(s)],6.35-6.7[1 H,m,6.58(d,J=5.5Hz)],6.75-8.0(12H,m), 8.3-8.7 [1H,m,8.42(s), 8.59(s)]。

【1276】

実施例 350

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-4.2,4.4-4.7 及び 4.9-5.2[全 23H,m,2.35(s), 2.53(s)],6.4-8.5 [12H,m,6.58(d,J=8.3Hz), 6.87(dd,J=8.3,J=2.3Hz), 6.99(d,J=2.2Hz), 7.10(d,J=8.3Hz)],10.0-10.0 4(1H,m)。

【1277】

実施例 352

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-1.55 及び 1.6-2.0[全 13H,1.25(t,J=7Hz)],2.2-2.8(3H,m), 3.2-3.55(2H,m), 3.6-3.9(1H,m), 4.0-4.4(2H,m), 4.6-4.9(1H,m), 6.29(1H,t,J=5.6Hz), 5.62(1H,d,J=8Hz), 6.89(1H,dd,J=8Hz,J=2Hz), 6.99(2H,d,J=8.2Hz), 7.18(2H,d,J=8.2Hz), 7.35(1H,d,J=2Hz)。

【1278】

実施例 353

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-2.0(10H, m), 2.2-2.8(3H,m), 3.2-3.6(2H,m), 3.65-3.9(1H, m), 4.6-4.95(1H,m), 6.28(1H,t,J=5.4Hz), 6.61(1 H,d,J=8Hz), 6.8-7.1(1H,m), 6.98(2H,d,J=8Hz), 7.21(2H,d,J=8Hz), 7.35(1H,d,J=2.3Hz), 9.03(1 H,brs)。

【1279】

J=6.1Hz)}, 8.1 - 8.5 {1 H, m, 8.15 (s), 8.41 (s)}.

{1274}

Working Example 345

compound

¹H-NHR (250 MHz, CDCl₃); de ppm: 0.9-4.1, 4.3-4.8 and 4.9-5.1 (All 24 H, m), 6.7-8.0 (11 H, m), 8.3-8.8 {1 H, m, 8.38 (s), 8.67 (s)}.

{1275}

Working Example 346

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm: 1.0-5.1 {24 H, m, 2.46 (s), 2.47 (s), 4.48 (s), 4.61 (s)}, 6.35-6.7 {1 H, m, 6.58 (d, J=5.5Hz)}, 6.75-8.0 (12 H, m), 8.3-8.7 {1 H, m, 8.42 (s), 8.59 (s)}.

{1276}

Working Example 350

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm: 1.2-4.2, 4.4-4.7 and 4.9-5.2 {All 23 H, m, 2.35 (s), 2.53 (s)}, 6.4-8.5 {12 H, m, 6.58 (d, J=8.3Hz), 6.87 (dd, J=8.3, J=2.3Hz), 6.99 (d, J=2.2Hz), 7.10 (d, J=8.3Hz)}, 10.0-10.04 (1 H, m).

{1277}

Working Example 352

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm: 1.05-1.55 and 1.6-2.0 {All 13 H, 1.25 (t, J=7Hz)}, 2.2-2.8 (3 H, m), 3.2-3.55 (2 H, m), 3.6-3.9 (1 H, m), 4.0-4.4 (2 H, m), 4.6-4.9 (1 H, m), 6.29 (1 H, t, J=5.6Hz), 5.62 (1 H, d, J=8Hz), 6.89 (1 H, dd, J=8Hz, J=2Hz), 6.99 (2 H, d, J=8.2Hz), 7.18 (2 H, d, J=8.2Hz), 7.35 (1 H, d, J=2Hz).

{1278}

Working Example 353

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm: 1.1-2.0 (10 H, m), 2.2-2.8 (3 H, m), 3.2-3.6 (2 H, m), 3.65-3.9 (1 H, m), 4.6-4.95 (1 H, m), 6.28 (1 H, t, J=5.4Hz), 6.61 (1 H, d, J=8Hz), 6.8-7.1 (1 H, m), 6.98 (2 H, d, J=8Hz), 7.21 (2 H, d, J=8Hz), 7.35 (1 H, d, J=2.3Hz), 9.03 (1 H, brs).

{1279}

実施例 354

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.15-2.8(2H, m), 3.25-3.6(2H,m), 3.65-3.95(1H,m), 4.6-4.9 (1H,m), 6.25(1H,t,J=5.6Hz), 6.63(1H,d,J=8.1Hz), 6.8-7.0(1H,m), 7.2-7.6(10H,m), 9.1(1H,br)。

【1280】

実施例 355

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-2.2,2.6-3.3 5,3.4-3.95,4.0-4.7 及び 5.05-5.25[全 14H,3.72 (s)],6.45-6.7[1H,m,6.63(d,J=7.6Hz)],6.8-7.5(12 H,m), 8.15-8.4(1H,m)。

【1281】

実施例 356

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-4.9 及び 5.0-5.25[全 17H,m,2.46(s), 3.70(s), 4.51(s)],6.4-7.6[12H,m,6.62(d,J=8.1Hz)],8.1-8.6(1H,m)。

【1282】

実施例 357

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-2.2(4H,m), 2.6-3.0(2H,m), 3.1-3.3,3.4-3.9,4.4-4.7 及び 4.9-5.2[全 8H,m,3.73(s), 4.56(s)],6.8-8.0,8.2-8.4 及び 8.45-8.6(全 12H,m)。

【1283】

実施例 358

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-2.25(4H, m), 2.5-5.2(7H,m), 6.2-8.1(11H,m), 8.3-8.8[1 H,m,8.42(s)]。

【1284】

実施例 359

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-4.7 及び 5.0-5.2[全 15H,m,2.48(s), 3.74(s)],6.3-6.7[1H,m, 6.57(d,J=8.7Hz)],6.7-7.8(10H,m), 8.3-8.8[1H, m,8.41(s), 8.72(s)]。

Working Example 354

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.15-2.8 (2 H, m), 3.25 - 3.6 (2 H, m), 3.65 - 3.95 (1 H, m), 4.6 - 4.9 (1 H, m), 6.25 (1 H, t, J=5.6Hz), 6.63 (1 H, d, J=8.1Hz), 6.8 - 7.0 (1 H, m), 7.2 - 7.6 (10 H, m), 9.1 (1 H, br).

{1280}

Working Example 355

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.1- 2.2, 2.6-3.35, 3.4- 3.95, 4.0-4.7 and 5.05 - 5.25 {All 14 H, 3.72 (s)}, 6.45 - 6.7 {1 H, m, 6.63 (d, J=7.6Hz)}, 6.8 - 7.5 (12 H, m), 8.15 - 8.4 (1 H, m).

{1281}

Working Example 356

compound

¹H-NMR (250 MHz, CDCl₃); de ppm :1.2- 4.9 and 5.0 - 5.25 {All 17 H, m, 2.46 (s), 3.70 (s), 4.51 (s)}, 6.4 - 7.6 {12 H, m, 6.62 (d, J=8.1Hz)}, 8.1 - 8.6 (1 H, m).

{1282}

Working Example 357

compound

¹H-NMR (250 MHz, CDCl₃); de ppm :1.1- 2.2 (4 H, m), 2.6 - 3.0 (2 H, m), 3.1 - 3.3, 3.4 - 3.9, 4.4 - 4.7 and 4.9 - 5.2 {All 8 H, m, 3.73 (s), 4.56 (s)}, 6.8 - 8.0, 8.2 - 8.4 and 8.45 - 8.6 (All 12 H, m).

{1283}

Working Example 358

compound

¹H-NMR (250 MHz, CDCl₃); de ppm :1.1- 2.25 (4 H, m), 2.5 - 5.2 (7 H, m), 6.2 - 8.1 (11 H, m), 8.3 - 8.8 {1 H, m, 8.42 (s)}.

{1284}

Working Example 359

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.2- 4.7 and 5.0 - 5.2 {All 15 H, m, 2.48 (s), 3.74 (s)}, 6.3 - 6.7 {1 H, m, 6.57 (d, J=8.7Hz)}, 6.7 - 7.8 (10 H, m), 8.3 - 8.8 {1 H, m, 8.41 (s), 8.72 (s)}.

【1285】

実施例 360

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-4.7 及び 5.0-5.2[全 15H,m,2.49(s), 3.68(s)],6.1-8.0[10H,m,6.60(d,J=8.4Hz)],9.4-9.8[1H,m,9.54(s), 9.75(s)],12.1-12.4[1H,m,12.27(s)]。

【1286】

実施例 361

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-3.9 及び 4.3-5.3[全 12H,m,2.45(s)],6.3-6.7[1H,m,6.57(d,J=8.4Hz)],6.7-7.8(10H,m), 8.40 及び 8.65(全 1H,各 s)。

【1287】

実施例 362

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-3.9,4.2-4.6 及び 4.9-5.2[全 12H,m,2.43(s)],6.3-7.9[11H,m,6.57(d,J=8.3Hz)],8.44 及び 8.74(全 1H,各 s)。

【1288】

実施例 363

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.7-2.4(2H,m), 2.87(2H,t,J=6Hz), 3.4-5.2[4H,m,4.55(s)],6.8-8.1(12H,m), 8.2-8.7[1H,m,8.35(s)]。

【1289】

実施例 365

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.1-5.1[12H,m,2.42(s)],6.4-8.8[13H,m,6.72(d,J=8.4Hz), 8.60(d,J=8.3Hz)],10.5-10.9(1H,m)。

【1290】

実施例 366

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.95-4.05,4.48-4.72 及び 4.96-5.14[全 27H,m,1.06(t,J=7.3Hz), 2.38(s)],6.48-7.73[12H,m,6.68(d,J=7.5Hz)]。

{1285}

Working Example 360

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.1- 4.7 and 5.0 - 5.2 {All 15 H, m, 2.49 (s) , 3.68 (s) }, 6.1 - 8.0 {10 H, m, 6.60 (d, J=8.4Hz) }, 9.4 - 9.8 {1 H, m, 9.54 (s) , 9.75 (s) }, 12.1- 12.4 {1 H, m, 12.27 (s) }.

{1286}

Working Example 361

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.1- 3.9 and 4.3 - 5.3 {All 12 H, m, 2.45 (s) }, 6.3 - 6.7 {1 H, m, 6.57 (d, J=8.4Hz) }, 6.7 - 7.8 (10 H, m), 8.40and 8.65 (All 1 H, each s).

{1287}

Working Example 362

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.1- 3.9, 4.2- 4.6 and 4.9 - 5.2 {All 12 H, m, 2.43 (s) }, 6.3 - 7.9 {11 H, m, 6.57 (d, J=8.3Hz) }, 8.44 and 8.74 (All 1 H, each s).

{1288}

Working Example 363

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.7-2.4 (2 H, m), 2.87 (2 H, t, J=6Hz), 3.4 - 5.2 {4 H, m, 4.55 (s) }, 6.8 - 8.1 (12 H, m), 8.2 - 8.7{1 H, m, 8.35 (s) }.

{1289}

Working Example 365

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.1- 5.1 {12 H, m, 2.42 (s) }, 6.4 - 8.8 {13 H, m, 6.72 (d, J=8.4Hz) , 8.60 (d, J=8.3Hz) }, 10.5 - 10.9 (1 H, m).

{1290}

Working Example 366

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.95-4.05, 4.48-4.72 and 4.96 - 5.14 {All 27 H, m, 1.06 (t, J=7.3Hz) , 2.38 (s) }, 6.48 - 7.73 {12 H, m, 6.68 (d, J=7.5Hz) }.

【1291】

実施例 367

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05(3H,t,J=7.3 Hz), 1.18-4.18,4.42-4.72 及び 4.97-5.15[全 24H, m,2.34(s)],6.40-6.68 及び 6.73-7.74[全 11H,m,6.61(d,J=8.3Hz)]。

【1292】

実施例 370

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05(3H,t,J=7.3 Hz), 1.20-2.32,2.59-4.00,4.43-4.72 及び 5.03-5.21(全 13H,m), 6.51-7.72[全 12H,m,6.69(d,J=7.4Hz)]。

【1293】

実施例 371

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05(3H,t,J=7.3 Hz), 1.17-2.28,2.55-3.90,4.34-4.66 及び 5.01-5.22(全 13H,m), 6.43-7.69[全 11H,m,6.63(d,J=8.3Hz)]。

【1294】

実施例 375

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.25(4H, m), 2.60-3.15(3H,m), 3.35-3.80(1H,m), 4.50-5.20(1H,m), 6.60-6.72(1H,m), 6.90-7.00(1H,m), 7.02(1H,d,J=8.2Hz), 7.16(1H,dd,J=2.3Hz,J=8.3 Hz), 7.21-7.54(5H,m)。

【1295】

実施例 377

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.28(4H, m), 2.50-3.18(3H,m), 3.31-3.60(1H,m), 4.48-5.19(1H,m), 7.02(1H,dd,J=1.7Hz,J=8.2Hz), 7.06-7.52(9H,m)。

【1296】

実施例 379

の化合物

J=7.5Hz) }。

{1291}

Working Example 367

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05 (3 H, t, J=7.3Hz), 1.18 - 4. 18 and 4. 42 - 4.72 and 4.97 - 5.15 {All 24 H, m, 2.34 (s) }, 6.40 - 6.68 and 6.73 - 7.74 {All 11 H, m, 6.61 (d, J=8.3Hz) }。

{1292}

Working Example 370

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05 (3 H, t, J=7.3Hz), 1.20 - 2. 32, 2, 59 - 4. 00 and 4. 43 - 4.72and 5.03 - 5.21 (All 13 H, m), 6.51 - 7.72 {All 12 H, m, 6.69 (d, J=7.4Hz) }。

{1293}

Working Example 371

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05 (3 H, t, J=7.3Hz), 1.17 - 2. 28 and 2. 55 - 3. 90 and 4. 34 -4.66 and 5.01 - 5.22 (All 13 H, m), 6.43 - 7.69 {All 11 H, m, 6.63 (d, J=8.3Hz) }。

{1294}

Working Example 375

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-2.25 (4 H, m), 2.60 - 3.15 (3 H, m), 3.35 - 3.80 (1 H, m), 4.50 - 5.20 (1 H, m),6.60 - 6.72 (1 H, m), 6.90 - 7.00 (1 H, m), 7.02 (1 H, d, J=8.2Hz), 7.16 (1 H, dd, J=2.3Hz , J=8.3Hz), 7.21 - 7.54 (5 H, m)。

{1295}

Working Example 377

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.13-2.28 (4 H, m), 2.50 - 3.18 (3 H, m), 3.31 - 3.60 (1 H, m), 4.48 - 5.19 (1 H, m),7.02 (1 H, dd, J=1.7Hz , J=8.2Hz), 7.06 - 7.52 (9 H, m)。

{1296}

Working Example 379

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-2.30(4H, m), 2.61-3.20(2H,m), 3.20-3.45(1H,m), 3.50-3.98(1H,m), 4.42-5.33(1H,m), 6.50-6.65(1H,m), 6.72-7.56(6H,m), 7.62(1H,dd,J=2.0Hz,J=8.8Hz), 7.71(1H,d,J=8.6Hz), 7.78-8.08(4H,m), 8.12(1H,d,J=8.6Hz)。

【1297】

実施例 383

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-2.22(7H, m), 2.69-3.93(6H,m), 4.41-5.23(1H,m), 6.45-7.73(11H,m)。

【1298】

実施例 385

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.28(7H, m), 2.56-3.08(4H,m), 3.08-3.96(2H,m), 4.40-5.21(1H,m), 6.40-7.16(4H,m), 7.16-7.75(8H,m)。

【1299】

実施例 386

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.70-1.16(6H, m), 1.20-3.66(18H,m), 3.66-3.97(1H,m), 4.48-5.19(1H,m), 6.51-7.21(2H,m), 7.21-8.10(7H, m)。

【1300】

実施例 387

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.80-1.18(3H, m), 1.19-2.58(10H,m), 2.58-3.21(4H,m), 3.29-3.80(4H,m), 4.52-5.11(1H,m), 6.40-6.87(1H,m), 6.90-7.11(2H,m), 7.11-7.44(4H,m), 7.44-7.68(3H,m)。

【1301】

実施例 388

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.85(3H,t,J=7.1 Hz), 1.02(3H,t,J=7.1Hz), 1.15-2.28(3H,m), 2.38(4H,q,J=7.1Hz), 2.56(4H,q,J=7.1Hz), 2.63-3.49(4H,m), 3.50-3.79(1H,m), 4.51-5.14(1H,m), 5.65-6.79(2H,m), 6.90-7.10(2H,m), 7.10-7.21(1H,

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.17-2.30 (4 H, m), 2.61 - 3.20 (2 H, m), 3.20 - 3.45 (1 H, m), 3.50 - 3.98 (1 H, m),4.42 - 5.33 (1 H, m), 6.50 - 6.65 (1 H, m), 6.72 - 7.56 (6 H, m), 7.62 (1 H, dd, J=2.0Hz , J=8.8Hz), 7.71 (1 H, d, J=8.6Hz), 7.78- 8.08 (4 H, m), 8.12 (1 H, d, J=8.6Hz) .

{1297}

Working Example 383

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.17-2.22 (7 H, m), 2.69 - 3.93 (6 H, m), 4.41 - 5.23 (1 H, m), 6.45 - 7.73 (11 H, m) .

{1298}

Working Example 385

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.28 (7 H, m), 2.56 - 3.08 (4 H, m), 3.08 - 3.96 (2 H, m), 4.40 - 5.21 (1 H, m),6.40 - 7.16 (4 H, m), 7.16 - 7.75 (8 H, m) .

{1299}

Working Example 386

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.70-1.16 (6 H, m), 1.20 - 3.66 (18 H, m), 3.66 - 3.97 (1 H, m), 4.48 - 5.19 (1 H, m),6.51 - 7.21 (2 H, m), 7.21 - 8.10 (7 H, m) .

{1300}

Working Example 387

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.80-1.18 (3 H, m), 1.19 - 2.58 (10 H, m), 2.58 - 3.21 (4 H, m), 3.29 - 3.80 (4 H, m),4.52 - 5.11 (1 H, m), 6.40 - 6.87 (1 H, m), 6.90 - 7.11 (2 H, m), 7.11 - 7.44 (4 H, m), 7.44 - 7.68 (3 H, m) .

{1301}

Working Example 388

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.85 (3 H, t, J=7.1Hz), 1.02 (3 H, t, J=7.1Hz), 1.15 - 2.28 (3 H, m), 2.38 (4 H, q, J=7.1Hz), 2.56 (4 H, q, J=7.1Hz), 2.63- 3.49 (4 H, m), 3.50 - 3.79 (1 H, m), 4.51 - 5.14 (1 H, m), 5.65 - 6.79 (2 H, m), 6.90 - 7.10(2 H, m),

m), 7.10-7.62(6H,m)。

【1302】

実施例 389

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.82-1.19(3H,m), 1.20-2.55(10H,m), 2.55-3.19(4H,m), 3.19-3.87(4H,m), 4.55-5.13(1H,m), 6.81-7.72(10H,m)。

【1303】

実施例 390

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm

0.84(3H,t,J=7.1Hz), 1.00(3H,t,J=7.2Hz), 1.21-2.42(8H,m), 2.42-2.68(4H,m), 2.68-3.46(3H,m), 3.52-3.81(1H,m), 4.53-5.14(1H,m), 5.65-6.51(1H,m), 6.88-7.11(2H,m), 7.11-7.22(1H,m), 7.11-7.65(8H,m)。

【1304】

実施例 391

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:0.88-1.27(3H,m), 1.30-2.89(10H,m), 2.99-3.20(1H,m), 3.20-4.12(7H,m), 4.45-5.29(1H,m), 6.48-6.67(1H,m), 6.75-6.90(1H,m), 7.02(1H,d,J=2.1Hz), 7.40-8.09(7H,m), 8.09-8.20(2H,m), 8.31(1H,d,J=8.6Hz)。

【1305】

実施例 392

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:0.81-1.19(6H,m), 1.25-2.30(4H,m), 2.30-2.77(7H,m), 2.77-5.30(6H,m), 6.29-6.78(2H,m), 6.81(1H,dd,J=2.2Hz,J=8.3Hz), 7.11-7.38(1H,m), 7.38-7.66(3H,m), 7.66-7.89(2H,m), 7.89-8.24(4H,m), 8.31(1H,d,J=8.6Hz)。

【1306】

実施例 393

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:0.78-2.30(5H,m), 2.35(3H,s), 2.41-2.60(3H,m), 2.60-3.52(3H,m), 3.52-4.01(5H,m), 4.46-5.26(1H,m), 6.50-

7.10 - 7.21 (1 H, m), 7.10 - 7.62 (6 H, m) .

{1302}

Working Example 389

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃) ; de ppm :0.82-1.19 (3 H, m), 1.20 - 2.55 (10 H, m), 2.55 - 3.19 (4 H, m), 3.19 - 3.87 (4 H, m), 4.55 - 5.13 (1 H, m), 6.81 - 7.72 (10 H, m) .

{1303}

Working Example 390

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃) ; de ppm :0.84 (3 H, t, J=7.1Hz) 1.00 (3 H, t, J=7.2Hz) , 1.21 - 2.42 (8 H, m), 2.42 - 2.68 (4 H, m), 2.68 - 3.46 (3 H, m), 3.52- 3.81 (1 H, m), 4.53 - 5.14 (1 H, m), 5.65 - 6.51 (1 H, m), 6.88 - 7.11 (2 H, m), 7.11 - 7.22(1 H, m), 7.11 - 7.65 (8 H, m) .

{1304}

Working Example 391

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃) ; de ppm :0.88-1.27 (3 H, m), 1.30 - 2.89 (10 H, m), 2.99 - 3.20 (1 H, m), 3.20 - 4.12 (7 H, m), 4.45 - 5.29 (1 H, m), 6.48 - 6.67 (1 H, m), 6.75 - 6.90 (1 H, m), 7.02 (1 H, d, J=2.1Hz) , 7.40 - 8.09(7 H, m), 8.09 - 8.20 (2 H, m), 8.31 (1 H, d, J=8.6Hz) .

{1305}

Working Example 392

compound

¹H-nmr (250 MHz , CDCl₃) ; de ppm :0.81-1.19 (6 H, m), 1.25 - 2.30 (4 H, m), 2.30 - 2.77 (7 H, m), 2.77 - 5.30(6 H, m), 6.29 - 6.78 (2 H, m), 6.81 (1 H, dd, J=2.2Hz , J=8.3Hz) , 7.11 - 7.38 (1 H, m), 7.38 - 7.66 (3 H, m), 7.66 -7.89 (2 H, m), 7.89 - 8.24 (4 H, m), 8.31 (1 H, d, J=8.6Hz) .

{1306}

Working Example 393

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃) ; de ppm :0.78-2.30 (5 H, m), 2.35 (3 H, s), 2.41 - 2.60 (3 H, m), 2.60 - 3.52 (3 H, m), 3.52 -4.01 (5 H, m), 4.46 - 5.26 (1 H,

6.69(1H,m), 6.89(1H,dd,J=2.2Hz,J=8.3Hz), 7.02(1H,d,J=2.2Hz), 7.09-7.20(1H,m), 7.28-7.55(1H,m), 7.60-7.90(6H,m), 8.38(1H,s)。

【1307】

実施例 394

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:0.79-1.20(6H,m), 1.29-2.82(10H,m), 2.82-4.02[9H,m,3.00(s), 3.22(s)],4.40-5.25(1H,m), 6.50-6.68(1H,m), 6.83-7.20(3H,m), 7.25-7.52(1H,m), 7.58-7.87(6H,m), 8.37(1H,d,J=5.2Hz)。

【1308】

実施例 397

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-4.18,4.40-4.72 及び 4.96-5.20[全 25H,m,2.34(s), 2.88(q,J=7.4Hz)],6.40-7.85(11H,m)。

【1309】

実施例 398

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-4.10,4.49-4.75 及び 4.98-5.18[全 25H,m,2.33(s)],6.45-7.72(12H,m)。

【1310】

実施例 404

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.28(10H,m), 2.54-4.08(15H,m), 4.18-5.22(1H,m), 6.50-6.70(2H,m), 6.72-6.90,(1H,m), 7.08-7.78(9H,m), 12.02(1H,brs)。

【1311】

実施例 408

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-5.15(17H,m), 2.86(3H,s), 6.49-6.70(2H,m), 6.72-6.90(1H,m), 6.93-7.81(9H,m), 12.27(1H,brs)。

【1312】

実施例 413

の化合物

m), 6.50 - 6.69 (1 H, m), 6.89 (1 H, dd, J=2.2Hz, J=8.3Hz), 7.02 (1 H, d, J=2.2Hz), 7.09 - 7.20(1 H, m), 7.28 - 7.55 (1 H, m), 7.60 - 7.90 (6 H, m), 8.38 (1 H, s)。

{1307}

Working Example 394

compound

¹H-NMR (250 MHz, CDCl₃); de ppm :0.79-1.20 (6 H, m), 1.29 - 2.82 (10 H, m), 2.82 - 4.02 {9 H, m, 3.00 (s), 3.22 (s)}, 4.40 - 5.25 (1 H, m), 6.50 - 6.68 (1 H, m), 6.83 - 7.20 (3 H, m), 7.25 - 7.52 (1 H, m), 7.58 - 7.87 (6 H, m), 8.37(1 H, d, J=5.2Hz)。

{1308}

Working Example 397

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.20-4.18, 4.40-4.72 and 4.96 - 5.20 {All 25 H, m, 2.34 (s), 2.88 (q, J=7.4Hz)}, 6.40 - 7.85 (11 H, m)。

{1309}

Working Example 398

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.15-4.10, 4.49-4.75 and 4.98 - 5.18 {All 25 H, m, 2.33 (s)}, 6.45 - 7.72 (12 H, m)。

{1310}

Working Example 404

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.18-2.28 (10 H, m), 2.54 - 4.08 (15 H, m), 4.18 - 5.22 (1 H, m), 6.50 - 6.70 (2 H, m), 6.72 - 6.90, (1 H, m), 7.08 - 7.78 (9 H, m), 12.02 (1 H, brs)。

{1311}

Working Example 408

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.15-5.15 (17 H, m), 2.86 (3 H, s), 6.49 - 6.70 (2 H, m), 6.72 - 6.90 (1 H, m), 6.93 - 7.81 (9 H, m), 12.27 (1 H, brs)。

{1312}

Working Example 413

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.46-4.00,4.27-4.80 及び 5.03-5.17(全 13H,m), 6.68(1H,d,J=8.3 Hz), 6.80-7.69(12H,m)。

【1313】

実施例 415

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-4.15 及び 4.80-5.10(全 13H,m), 6.45-7.90(12H,m)。

【1314】

実施例 417

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.87(3H,t,J=7.3 Hz), 1.35-2.22,2.66-3.17 及び 4.88-5.09(全 10H,m), 4.08(2H,t,J=7.3Hz), 6.57(1H,d,J=8.3Hz), 6.89(1H,dd,J=2Hz,J=8.3Hz), 7.15-7.49(3H,m), 7.53-7.69(2H,m), 11.39-11.64(1H,brs)。

【1315】

実施例 418

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.99-4.17 及び 4.45-4.65[全 25H,m,1.84(s)],6.56-6.65,6.82-7.02 及び 7.11-7.58(全 6H,m), 7.75-7.96(1H,m), 8.50-8.66(1H,m), 8.71-8.93(1H,m)。

【1316】

実施例 419

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.64-0.85,1.10-4.00,4.40-4.70 及び 5.58-5.72(全 17H,m), 6.36-7.62(8H,m), 7.75-7.96(1H,m), 8.49-8.70(1H,m), 8.70-8.95(1H,m)。

【1317】

実施例 420

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-4.2,4.45-4.6[全 20H,m,2.04(s), 2.34(s)],5.15 及び 5.22(全 2 H,各 s), 6.8-7.8(全 12H,m)。

【1318】

実施例 421

の化合物

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.46-4.00, 4.27-4.80 and 5.03 - 5.17 (All 13 H, m), 6.68 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.80 - 7.69 (12 H, m).

{1313}

Working Example 415

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-4.15 and 4.80 - 5.10 (All 13 H, m), 6.45 - 7.90 (12 H, m).

{1314}

Working Example 417

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.87 (3 H, t, J=7.3Hz), 1.35 - 2.22 and 2.66 - 3.17 and 4.88 - 5.09(All 10 H, m), 4.08 (2 H, t, J=7.3Hz), 6.57 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.89 (1 H, dd, J=2Hz , J=8.3Hz), 7.15 - 7.49 (3 H, m), 7.53 - 7.69 (2 H, m), 11.39 -11.64 (1 H, brs).

{1315}

Working Example 418

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.99-4.17 and 4.45 - 4.65 {All 25 H, m, 1.84 (s) }, 6.56 - 6.65 and 6.82 - 7.02and 7.11 - 7.58 (All 6 H, m), 7.75 - 7.96 (1 H, m), 8.50 - 8.66 (1 H, m), 8.71 - 8.93 (1 H, m).

{1316}

Working Example 419

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.64-0.85, 1.10-4.00, 4.40-4.70 and 5.58 - 5.72 (All 17 H, m), 6.36 - 7.62 (8 H, m), 7.75 - 7.96 (1 H, m),8.49 - 8.70 (1 H, m), 8.70 - 8.95 (1 H, m).

{1317}

Working Example 420

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.2- 4.2, 4.45-4.6 {All 20 H, m, 2.04 (s), 2.34 (s) }, 5.15 and 5.22 (All 2 H, each s), 6.8 - 7.8 (All 12 H, m).

{1318}

Working Example 421

compound

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.40-1.85,1.85-2.14,2.68-3.10 及び 4.85-5.06(全 8H,m), 2.53 及び 2.59(全 3H,各 s), 6.60(1H,d,J=8.3Hz), 6.85(1H,dd,J=2.9Hz,J=8.3Hz), 6.96(1H,d,J=7.9Hz), 7.12-7.22(2H,m), 7.29,7.40 及び 7.58(全 2H,各 s), 7.89-8.09(1H,m), 8.43-8.66(1H,m), 8.69-8.86(1H,m), 8.90-9.11(1H,m)。

【1319】

実施例 422

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-2.10,2.32-2.90,3.20-3.45 及び 4.70-4.90(全 8H,m), 6.42(1H,d,J=6.8Hz), 6.71(1H,dd,J=2.0Hz,J=6.8Hz), 6.85(1H,d,J=2.0Hz), 7.00-7.65(10H,m)。

【1320】

実施例 423

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.36-1.73,1.84-2.25,2.65-3.16 及び 4.93-5.16(全 8H,m), 6.61(1H,d,J=8.3Hz), 6.90(1H,dd,J=2Hz,J=8.3Hz), 7.08-7.70(10H,m)。

【1321】

実施例 424

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-4.00 及び 4.45-4.65[全 23H,m,1.62,2.34(s), 2.54(s)],6.55-6.65,6.82-7.01 及び 7.10-7.56(全 6H,m), 7.74-7.93(1H,m), 8.50-8.67(1H,m), 8.74-8.90(1H,m)。

【1322】

実施例 425

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.38-2.22,2.65-3.15 及び 4.95-5.12(全 8H,m), 6.61(1H,d,J=8.4Hz), 6.80-7.00(2H,m), 7.20-7.38(4H,m), 7.62(1H,d,J=9.1Hz), 7.98(2H,d,J=8.3Hz), 8.09(1H,d,J=6.9Hz)。

【1323】

実施例 426

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:0.90-1.90,1.90-2.23,2.46-2.70 及び 4.67-4.90(全 8H,m), 8.44(1H,d,J=8.4Hz), 6.75(1H,dd,J=2.4Hz,J=8.4Hz), 6.

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.40-1.85, 1.85-2.14, 2.68-3.10 and 4.85 - 5.06 (All 8 H, m), 2.53 and 2.59 (All 3 H, each s), 6.60 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.85(1 H, dd, J=2.9Hz , J=8.3Hz), 6.96 (1 H, d, J=7.9Hz), 7.12 - 7.22 (2 H, m), 7.29 and 7.40 and 7.58 (All 2 H, each s), 7.89 -8.09 (1 H, m), 8.43 - 8.66 (1 H, m), 8.69 - 8.86 (1 H, m), 8.90 - 9.11 (1 H, m).

{1319}

Working Example 422

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.75-2.10, 2.32-2.90, 3.20-3.45 and 4.70 - 4.90 (All 8 H, m), 6.42 (1 H, d, J=6.8Hz), 6.71 (1 H, dd, J=2.0Hz , J=6.8Hz), 6.85 (1 H, d, J=2.0Hz), 7.00- 7.65 (10 H, m).

{1320}

Working Example 423

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.36-1.73, 1.84-2.25, 2.65-3.16 and 4.93 - 5.16 (All 8 H, m), 6.61 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.90 (1 H, dd, J=2Hz , J=8.3Hz), 7.08 - 7.70(10 H, m).

{1321}

Working Example 424

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-4.00 and 4.45 - 4.65 {All 23 H, m, 1.62, 2.34 (s), 2.54 (s) }, 6.55 - 6.65 and 6.82 - 7.01and 7.10 - 7.56 (All 6 H, m), 7.74 - 7.93 (1 H, m), 8.50 - 8.67 (1 H, m), 8.74 - 8.90 (1 H, m).

{1322}

Working Example 425

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.38-2.22, 2.65-3.15 and 4.95 - 5.12 (All 8 H, m), 6.61 (1 H, d, J=8.4Hz), 6.80 - 7.00 (2 H, m), 7.20 -7.38 (4 H, m), 7.62 (1 H, d, J=9.1Hz), 7.98 (2 H, d, J=8.3Hz), 8.09 (1 H, d, J=6.9Hz).

{1323}

Working Example 426

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :0.90-1.90, 1.90-2.23, 2.46-2.70 and 4.67 - 4.90 (All 8 H, m), 8.44 (1 H, d, J=8.4Hz), 6.75 (1 H, dd, J=2.4Hz ,

92(1H,d,J=2.4Hz), 7.05-7.75 及び 7.96-8.04(全 6 H,m), 8.30-8.45,8.53-8.74 及び 8.80-8.87(全 2H, m)。

【1324】

実施例 433

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.22-3.13,3.44-3.73 及び 4.71-4.93(全 8H,m), 6.80(1H,dd,J=2.5 Hz,J=8.5Hz), 6.96-7.85(9H,m), 8.63-8.76(1H, m)。

【1325】

実施例 436

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-4.2,4.4-4.7 及び 5.0-5.2[全 16H,m,2.34(s)],6.5-6.75(1H, m), 6.8-7.8[全 11H,m,7.50(d,J=6.7Hz), 7.70(d,J=5.7Hz)]。

【1326】

実施例 438

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.22-3.95,4.43-4.62 及び 5.03-5.24[全 30H,m), 2.34(s)],6.56 及び 6.63(全 1H,各 d,J=8.3Hz), 6.89-7.32(4H,m), 7.37-7.55(2H,m)。

【1327】

実施例 440

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.84-4.00 及び 4.39-4.60(全 22H,m), 6.23-6.39(2H,m), 6.50-6.6 6(1H,m), 6.82-6.99(1H,m), 6.99-7.15(3H,m), 7. 15-7.36(2H,m), 7.42-7.62(2H,m)。

【1328】

実施例 441

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.80-4.00 及び 4.38-4.65[全 32H,m,1.92(s), 3.23(s)],5.85 及び 5.87(全 2H,各 s), 6.57(1H,d,J=8.5Hz), 6.80-7.20 (4H,m), 7.45-7.65(2H,m)。

【1329】

実施例 444

の化合物

J=8.4Hz), 6.92 (1 H, d, J=2.4Hz), 7.05- 7.75 and 7.96 - 8.04 (All 6 H, m), 8.30 - 8. 45 and 8. 53 - 8.74 and 8.80 -8.87 (All 2 H, m)。

{1324}

Working Example 433

compound

¹H-NHR (250 MHz, CDCl₃);de ppm :1.22-3.13, 3.44-3.73 and 4.71 - 4.93 (All 8 H, m), 6.80 (1 H, dd, J=2.5Hz, J=8.5Hz), 6.96 - 7.85 (9 H, m), 8.63 -8.76 (1 H, m)。

{1325}

Working Example 436

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.15-4.2, 4.4- 4.7 and 5.0 - 5.2 {All 16 H, m, 2.34 (s) }, 6.5 - 6.75 (1 H, m), 6.8 - 7.8 {All 11 H, m, 7.50 (d, J=6.7Hz), 7.70 (d, J=5.7Hz) }。

{1326}

Working Example 438

compound

¹H-NHR (250 MHz, CDCl₃);de ppm :1.22-3.95, 4.43-4.62 and 5.03 - 5.24 {All 30 H, m), 2.34 (s) }, 6.56 and 6.63 (All 1 H, each d, J=8.3Hz), 6.89 - 7.32(4 H, m), 7.37 - 7.55 (2 H, m)。

{1327}

Working Example 440

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :0.84-4.00 and 4.39 - 4.60 (All 22 H, m), 6.23 - 6.39 (2 H, m), 6.50 - 6.66 (1 H, m),6.82 - 6.99 (1 H, m), 6.99 - 7.15 (3 H, m), 7.15 - 7.36 (2 H, m), 7.42 - 7.62 (2 H, m)。

{1328}

Working Example 441

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :0.80-4.00 and 4.38 - 4.65 {All 32 H, m, 1.92 (s), 3.23 (s) }, 5.85 and 5.87 (All 2 H, each s), 6.57 (1 H, d, J=8.5Hz), 6.80- 7.20 (4 H, m), 7.45 - 7.65 (2 H, m)。

{1329}

Working Example 444

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.57-2.34(4H, m), 2.51-2.90(2H,m), 4.74-5.23(2H,m), 6.53-6.76(2H,m), 6.91-7.62(9H,m)。

【1330】

実施例 445

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.75-2.0,2.2-3.10 及び 3.45-4.10(全 18H,m), 4.65(2H,s), 6.66-7.70[全 11H,m,6.67(d,J=8.6Hz)],7.59(d,J=8.5Hz), 8.80(1H,s)。

【1331】

実施例 446

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.8-2.0 及び 2.25-2.50(全 6H,m), 2.31(3H,s), 2.60(1H,dd,J=15.7Hz,J=8.3Hz), 2.80(1H,dd,J=15.7Hz,J=5.7Hz), 3.45-3.60(3H,m), 3.60-3.80(2H,m), 3.89(2H,t,J=6.6Hz), 4.60(2H,s), 6.67(1H,d,J=8.7Hz), 6.88(1H,dd,J=8.7Hz,J=2.2Hz), 7.00-7.50(8H,m), 7.56(2H,d,J=8.6Hz), 8.41(1H,s)。

【1332】

実施例 447

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.65-2.0 及び 2.1-2.55[全 12H,m,2.32(s), 2.35(s)],2.60(1H,dd,J=15.7Hz,J=8.2Hz), 2.80(1H,dd,J=15.7Hz,J=5.8Hz), 3.48-3.52 及び 3.67-3.72(全 5H,m), 3.89(2H,t,J=6.6Hz), 4.59(2H,s), 6.67(1H,d,J=8.6Hz), 6.78(2H,d,J=8Hz), 6.87(2H,d,J=8.6Hz), 7.20(2H,d,J=8Hz), 7.37(2H,d,J=8.6Hz), 7.55(2H,d,J=8.6Hz), 8.37(1H,s)。

【1333】

実施例 448

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.70-2.10,2.20-2.90 及び 3.50-4.0[全 21H,m,2.23(s), 2.31(s)],4.71(2H,s), 6.68(1H,d,J=8.6Hz), 6.85-7.03,7.15-7.43 及び 7.60-7.67(全 11H,m), 9.57(1H,s)。

【1334】

実施例 450

の化合物

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.57-2.34 (4 H, m), 2.51 - 2.90 (2 H, m), 4.74 - 5.23 (2 H, m), 6.53 - 6.76 (2 H, m),6.91 - 7.62 (9 H, m).

{1330}

Working Example 445

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.75-2.0, 2.2- 3.10 and 3.45 - 4.10 (All 18 H, m), 4.65 (2 H, s), 6.66 - 7.70 {All 11 H, m, 6.67 (d, J=8.6Hz) }, 7.59(d, J=8.5Hz), 8.80 (1 H, s).

{1331}

Working Example 446

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.8-2.0 and 2.25 - 2.50 (All 6 H, m), 2.31 (3 H, s), 2.60 (1 H, dd, J=15.7Hz , J=8.3Hz), 2.80 (1 H, dd, J=15.7Hz , J=5.7Hz), 3.45- 3.60 (3 H, m), 3.60 - 3.80 (2 H, m), 3.89 (2 H, t, J=6.6Hz), 4.60 (2 H, s), 6.67 (1 H, d, J=8.7Hz), 6.88 (1 H, dd, J=8.7Hz , J=2.2Hz), 7.00 -7.50 (8 H, m), 7.56 (2 H, d, J=8.6Hz), 8.41 (1 H, s).

{1332}

Working Example 447

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.65-2.0 and 2.1 - 2.55 {All 12 H, m, 2.32 (s), 2.35 (s) }, 2.60 (1 H, dd, J=15.7Hz , J=8.2Hz), 2.80 (1 H, dd, J=15.7Hz , J=5.8Hz), 3.48 - 3.52and 3.67 - 3.72 (All 5 H, m), 3.89 (2 H, t, J=6.6Hz), 4.59 (2 H, s), 6.67 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.78 (2 H, d, J=8Hz), 6.87 (2 H, d, J=8.6Hz), 7.20(2 H, d, J=8Hz), 7.37 (2 H, d, J=8.6Hz), 7.55 (2 H, d, J=8.6Hz), 8.37 (1 H, s).

{1333}

Working Example 448

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.70-2.10, 2.20-2.90 and 3.50 - 4.0 {All 21 H, m, 2.23 (s), 2.31 (s) }, 4.71 (2 H, s), 6.68 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.85 - 7.03and 7.15 - 7.43 and 7.60 - 7.67 (All 11 H, m), 9.57 (1 H, s).

{1334}

Working Example 450

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.96-4.70(29H, m), 1.45(3H,t,J=7.0Hz), 4.07(2H,q,J=7.0Hz), 5.58-7.36(7H,m)。

【1335】

実施例 455

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.95-4.00,4.42-4.63 及び 5.04-5.18(全 22H,m), 6.46-6.67(1H, m), 6.79-6.95(1H,m), 6.95-7.25(4H,m), 7.32-7.51(2H,m), 7.52-7.75(2H,m)。

【1336】

実施例 456

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.95-3.93,4.41-4.62 及び 5.01-5.20[全 25H,m,2.24(s)],6.45-6.62 (1H,m), 6.72-6.95(2H,m), 6.95-7.08(1H,m), 7.10-7.45(3H,m), 7.45-7.69(2H,m)。

【1337】

実施例 459

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.42(6H,t,J=7.2 Hz), 1.75-2.05(1H,m), 2.15-2.40(1H,m), 2.40-3.90(11H,m), 3.94(2H,t,J=6.5Hz), 6.73-7.15(3 H,m), 7.25-7.60(10H,m), 8.35-8.75(1H,m), 11.3-11.7(1H,m)。

【1338】

実施例 460

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.24(3H,t,J=7H z), 1.4-1.5,1.85-3.30,3.40-4.20 及び 4.65-4.85(全 15H,m), 3.72(2H,q,J=7Hz), 6.8-7.7(13H,m), 12.6-12.9(1H,m)。

【1339】

実施例 461

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03(6H,t,J=7H z), 1.75-2.0(1H,m), 2.10-2.30(1H,m), 2.35-2.90 (8H,m), 3.35-3.80(3H,m), 3.90(2H,t,J=6.6Hz), 6.72(1H,d,J=8.6Hz), 6.8-7.0(2H,m), 7.23(1H,d,J =2.2Hz), 7.35-7.66(9H,m)。

【1340】

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.96-4.70 (29 H, m), 1.45 (3 H, t, J=7.0Hz), 4.07 (2 H, q, J=7.0Hz), 5.58 - 7.36 (7 H, m) .

{1335}

Working Example 455

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.95-4.00, 4.42-4.63 and 5.04 - 5.18 (All 22 H, m), 6.46 - 6.67 (1 H, m), 6.79 - 6.95 (1 H, m),6.95 - 7.25 (4 H, m), 7.32 - 7.51 (2 H, m), 7.52 - 7.75 (2 H, m) .

{1336}

Working Example 456

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.95-3.93, 4.41-4.62 and 5.01 - 5.20 {All 25 H, m, 2.24 (s) }, 6.45 - 6.62 (1 H, m), 6.72 - 6.95 (2 H, m),6.95 - 7.08 (1 H, m), 7.10 - 7.45 (3 H, m), 7.45 - 7.69 (2 H, m) .

{1337}

Working Example 459

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.42 (6 H, t, J=7.2Hz), 1.75 - 2.05 (1 H, m), 2.15 - 2.40 (1 H, m), 2.40 - 3.90 (11 H, m),3.94 (2 H, t, J=6.5Hz), 6.73 - 7.15 (3 H, m), 7.25 - 7.60 (10 H, m), 8.35 - 8.75 (1 H, m), 11.3 - 11.7(1 H, m) .

{1338}

Working Example 460

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.24 (3 H, t, J=7Hz), 1.4 - 1.5 and 1.85 - 3.30 and 3.40 -4.20 and 4.65 - 4.85 (All 15 H, m), 3.72 (2 H, q, J=7Hz), 6.8 - 7.7 (13 H, m), 12.6 - 12.9 (1 H, m) .

{1339}

Working Example 461

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.03 (6 H, t, J=7Hz), 1.75 - 2.0 (1 H, m), 2.10 - 2.30 (1 H, m), 2.35 - 2.90 (8 H, m),3.35 - 3.80 (3 H, m), 3.90 (2 H, t, J=6.6Hz), 6.72 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.8 - 7.0 (2 H, m), 7.23 (1 H, d, J=2.2Hz), 7.35 - 7.66(9 H, m) .

{1340}

実施例 462

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03(3H,t,J=7.2 Hz), 1.75-2.0(1H,m), 2.15-2.40(1H,m), 2.40-2.90(8H,m), 3.50-3.60(3H,m), 3.65-3.85(2H,m), 3.93(2H,m), 6.75-7.0 及び 7.2-7.65(全 12H,m)。

【1341】

実施例 463

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-1.70,1.70-3.0,3.0-3.6,3.6-3.8 及び 3.8-4.0(全 32H,m), 6.73(1H,d,J=8.6Hz), 6.87(1H,dd,J=8.6Hz,J=2.4Hz), 7.13(2H,d,J=8Hz), 7.23(1H,d,J=2.4Hz), 7.33(2H,d,J=8Hz), 8.4-8.7(1H,m), 11.2-11.6(1H,m)。

【1342】

実施例 464

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10(3H,t,J=7.2 Hz), 1.2-1.65,1.7-2.0,2.1-2.9,3.4-3.6,3.6-3.8 及び 3.8-4.0(全 28H,m), 6.77(1H,d,J=8.7Hz), 6.90(1H,dd,J=8.7Hz,J=2.3Hz), 7.13(2H,d,J=8.2Hz), 7.19(1H,d,J=2.3Hz), 7.31(2H,d,J=8.2Hz)。

【1343】

実施例 467

の化合物

¹H-NHR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-2.10,2.55-4.05,4.45-4.61 及び 4.68-4.71(全 41H,m), 6.94-7.38(3H,m), 12.00-12.27(1H,brs)。

【1344】

実施例 469

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.24(5H,m), 2.63-3.31(3H,m), 3.70 及び 3.75(全 3H,s), 4.08-5.20(1H,m), 6.46-6.62(1H,m), 6.36-7.00(1H,m), 7.10-7.48(3H,m), 8.43-8.56(2H,m)。

【1345】

実施例 470

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-5.08(26H,m), 6.15-7.53(16H,m)。

Working Example 462

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.03 (3 H, t, J=7.2Hz), 1.75 - 2.0 (1 H, m), 2.15 - 2.40 (1 H, m), 2.40 - 2.90 (8 H, m),3.50 - 3.60 (3 H, m), 3.65 - 3.85 (2 H, m), 3.93 (2 H, m), 6.75 - 7.0 and 7.2 - 7.65 (All 12 H, m).

{1341}

Working Example 463

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-1.70, 1.70-3.0, 3.0-3.6, 3.6-3.8 and 3.8 - 4.0 (All 32 H, m), 6.73 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.87 (1 H, dd, J=8.6Hz , J=2.4Hz), 7.13 (2 H, d, J=8Hz), 7.23(1 H, d, J=2.4Hz), 7.33 (2 H, d, J=8Hz), 8.4 - 8.7 (1 H, m), 11.2 - 11.6 (1 H, m).

{1342}

Working Example 464

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10 (3 H, t, J=7.2Hz), 1.2 - 1.65,1.7 - 2.02,1 - 2.93,4 - 3.63,6 - 3.8and 3.8 - 4.0 (All 28 H, m), 6.77 (1 H, d, J=8.7Hz), 6.90 (1 H, dd, J=8.7Hz , J=2.3Hz), 7.13 (2 H, d, J=8.2Hz), 7.19 (1 H, d, J=2.3Hz), 7.31 (2 H, d, J=8.2Hz).

{1343}

Working Example 467

compound

¹H-NHR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-2.10, 2.55-4.05, 4.45-4.61 and 4.68 - 4.71 (All 41 H, m), 6.94 - 7.38 (3 H, m), 12.00 - 12.27(1 H, brs).

{1344}

Working Example 469

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-2.24 (5 H, m), 2.63 - 3.31 (3 H, m), 3.70 and 3.75 (All 3 H, s), 4.08 - 5.20(1 H, m), 6.46 - 6.62 (1 H, m), 6.36 - 7.00 (1 H, m), 7.10 - 7.48 (3 H, m), 8.43 - 8.56 (2 H, m).

{1345}

Working Example 470

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05-5.08 (26 H, m), 6.15 - 7.53 (16 H, m).

【1346】

実施例 471

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.97-2.20,2.20-4.06 及び 4.40-4.63[全 36H,m), 1.41(t,J=7.2Hz), 1.71(s), 3.31(s)],6.59(1H,d,J=8.5Hz), 6.84-7.60(6H,m), 12.7-13.4(1H,brs)。

【1347】

実施例 472

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.26,2.50-4.10,4.40-4.60 及び 5.00-5.15(全 29H,m), 6.58(1H,d,J=8.2Hz), 6.65-7.48(6H,m), 12.12(1H,brs)。

【1348】

実施例 473

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.30-2.20,2.50-4.10,4.38-4.60 及び 4.98-5.16(全 29H,m), 6.50-7.20(5H,m), 7.36(2H,d,J=8.6Hz), 12.15(1H,brs)。

【1349】

実施例 476

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-4.10 及び 4.30-4.53(全 35H,m), 6.47-6.80,6.80-7.65 及び 7.86-8.10(全 7H,m), 15.51-15.98(1H,br)。

【1350】

実施例 477

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.11(4H,m), 2.45-3.78(5H,m), 4.23-5.10(1H,m), 6.61-7.75(14H,m)。

【1351】

実施例 478

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.62(1.5H,d,J=6.5Hz), 0.99(1.5H,d,J=6.5Hz), 1.03-5.74(14H,m), 6.43-7.80(11H,m)。

{1346}

Working Example 471

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.97-2.20, 2.20-4.06 and 4.40 - 4.63 {All 36 H, m} , 1.41 (t, J=7.2Hz) , 1.71 (s) , 3.31 (s) } , 6.59 (1 H, d, J=8.5Hz) , 6.84 - 7.60 (6 H, m) , 12.7 -13.4 (1 H, brs) .

{1347}

Working Example 472

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-2.26, 2.50-4.10, 4.40-4.60 and 5.00 - 5.15 (All 29 H, m) , 6.58 (1 H, d, J=8.2Hz) , 6.65 - 7.48 (6 H, m) , 12.12(1 H, brs) .

{1348}

Working Example 473

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.30-2.20, 2.50-4.10, 4.38-4.60 and 4.98 - 5.16 (All 29 H, m) , 6.50 - 7.20 (5 H, m) , 7.36 (2 H, d, J=8.6Hz) , 12.15(1 H, brs) .

{1349}

Working Example 476

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-4.10 and 4.30 - 4.53 (All 35 H, m) , 6.47 - 6.80 and 6.80 - 7.65and 7.86 - 8.10 (All 7 H, m) , 15.51 - 15.98 (1 H, br) .

{1350}

Working Example 477

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.12-2.11 (4 H, m) , 2.45 - 3.78 (5 H, m) , 4.23 - 5.10 (1 H, m) , 6.61 - 7.75(14 H, m) .

{1351}

Working Example 478

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.62 (1.5 H, d, J=6.5Hz) , 0.99 (1.5 H, d, J=6.5Hz) , 1.03 - 5.74 (14 H, m) , 6.43 - 7.80 (11 H, m) .

【1352】

実施例 479

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.80-3.90,4.41-4.64 及び 5.05-5.70(全 35H,m), 6.49-6.63(1H,m), 6.71-7.20(4H,m), 7.20-7.50(2H,m)。

【1353】

実施例 480

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.92-2.25,2.38-3.27,3.27-4.00,4.50-4.60 及び 4.85-5.02(全 29H,m), 6.62-7.45(6H,m)。

【1354】

実施例 481

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.82-4.17,4.36-4.60 及び 5.07-5.13[全 26H,m,2.99(s), 3.23(s)], 6.40-6.66(1H,m), 6.75-7.78(8H,m), 7.84(1H,d,J=3.7Hz)。

【1355】

実施例 482

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.77-1.14,1.14-2.24,2.24-4.04,4.33-4.53 及び 4.97-5.13[全 27H,m,2.89(s), 3.14(s)],6.42-6.61(1H,m), 6.77-7.10(2H,m), 7.28-7.80,7.80-8.12[全 6H,m,7.88(s)]。

【1356】

実施例 484

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-5.33(22H,m), 6.49-7.32(12H,m), 11.92-12.70(1H,m)。

【1357】

実施例 485

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-5.28(20H,m), 1.38(3H,t,J=7.2Hz), 3.32(3H,s), 6.61(1H,d,J=8.3Hz), 6.91(1H,dd,J=8.3,J=2.2Hz), 7.03(1H,d,J=2.2Hz), 7.18-7.76(9H,m), 11.94(1H,brs)。

{1352}

Working Example 479

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.80-3.90, 4.41-4.64 and 5.05 - 5.70 (All 35 H, m), 6.49 - 6.63 (1 H, m), 6.71 - 7.20 (4 H, m),7.20 - 7.50 (2 H, m).

{1353}

Working Example 480

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.92-2.25, 2.38-3.27, 3.27-4.00, 4.50-4.60 and 4.85 - 5.02 (All 29 H, m), 6.62 - 7.45 (6 H, m).

{1354}

Working Example 481

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.82-4.17, 4.36-4.60 and 5.07 - 5.13 {All 26 H, m, 2.99 (s), 3.23 (s) }, 6.40 - 6.66 (1 H, m), 6.75 - 7.78 (8 H, m),7.84 (1 H, d, J=3.7Hz).

{1355}

Working Example 482

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.77-1.14, 1.14-2.24, 2.24-4.04, 4.33-4.53 and 4.97 - 5.13 {All 27 H, m, 2.89 (s), 3.14 (s) }, 6.42 - 6.61 (1 H, m), 6.77 - 7.10 (2 H, m),7.28 - 7.80 and 7.80 - 8.12 {All 6 H, m, 7.88 (s) }.

{1356}

Working Example 484

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-5.33 (22 H, m), 6.49 - 7.32 (12 H, m), 11.92 - 12.70 (1 H, m).

{1357}

Working Example 485

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-5.28 (20 H, m), 1.38 (3 H, t, J=7.2Hz), 3.32 (3 H, s), 6.61 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.91 (1 H, dd, J=8.3, J=2.2Hz), 7.03 (1 H, d, J=2.2Hz),7.18 - 7.76 (9 H, m), 11.94 (1 H, brs).

【1358】

実施例 486

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-5.13(24H, m), 1.35(3H,t,J=7.3Hz), 1.45(3H,t,J=7.0Hz), 4.08(2H,q,J=7.0Hz), 6.18-7.46(6H,m), 11.59-12.58(1H,m)。

【1359】

実施例 487

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.93-3.98(26H, m), 4.51-5.15(1H,m), 4.97 及び 5.10(全 2H,s), 6.23-7.51(11H,m)。

【1360】

実施例 488

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.90-2.12,2.12-2.40,2.40-3.63 及び 4.45-4.84(全 38H,m), 6.98-7.35(2H,m), 7.38-7.44(1H,m)。

【1361】

実施例 489

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.06-5.19(36H, m), 6.16-7.49(6H,m), 11.28-11.99(1H,m)。

【1362】

実施例 490

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.32-4.57(22H, m), 1.45(3H,t,J=7.0Hz), 2.58 及び 2.60(全 3H,s), 4.08(2H,q,J=7.0Hz), 6.43-6.63(2H,m), 7.05-7.44(4H,m), 12.15(1H,brs)。

【1363】

実施例 491

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-5.21(31H, m), 6.11-7.61(6H,m), 8.54-8.72(1H,m), 11.27-12.03(1H,m)。

【1364】

実施例 492

{1358}

Working Example 486

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-5.13 (24 H, m), 1.35 (3 H, t, J=7.3Hz), 1.45 (3 H, t, J=7.0Hz), 4.08 (2 H, q, J=7.0Hz), 6.18 - 7.46 (6 H, m),11.59 - 12.58 (1 H, m).

{1359}

Working Example 487

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.93-3.98 (26 H, m), 4.51 - 5.15 (1 H, m), 4.97 and 5.10 (All 2 H, s), 6.23 - 7.51(11 H, m).

{1360}

Working Example 488

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.90-2.12, 2.12-2.40, 2.40-3.63 and 4.45 - 4.84 (All 38 H, m), 6.98 - 7.35 (2 H, m), 7.38 - 7.44 (1 H, m).

{1361}

Working Example 489

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.06-5.19 (36 H, m), 6.16 - 7.49 (6 H, m), 11.28 - 11.99 (1 H, m).

{1362}

Working Example 490

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.32-4.57 (22 H, m), 1.45 (3 H, t, J=7.0Hz), 2.58 and 2.60 (All 3 H, s), 4.08 (2 H, q, J=7.0Hz), 6.43 - 6.63(2 H, m), 7.05 - 7.44 (4 H, m), 12.15 (1 H, brs).

{1363}

Working Example 491

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.20-5.21 (31 H, m), 6.11 - 7.61 (6 H, m), 8.54 - 8.72 (1 H, m), 11.27 - 12.03(1 H, m).

{1364}

Working Example 492

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.23-5.03(25H, m), 1.46(3H,t,J=7.0Hz), 4.08(2H,q,J=7.0Hz), 6.16-7.44(6H,m), 12.47(1H,brs)。

【1365】

実施例 493

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-4.67(29H, m), 4.97-5.10(全 2H,s), 6.22-7.51(11H,m), 11.4 3 及び 12.04(1H,m)。

【1366】

実施例 494

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.21-4.62(26H, m), 4.98 及び 5.11(全 2H,s), 6.22-7.51(11H,m), 8.55-8.71(1H,m), 11.39-11.81(1H,m)。

【1367】

実施例 495

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.21-4.90(22H, m), 1.34(3H,t,J=7.3Hz), 4.98 及び 5.11(全 2H,s), 6.27-7.53(11H,m), 12.48(1H,brs)。

【1368】

実施例 496

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.83-3.98(24H, m), 2.99 及び 3.15(全 3H,s), 3.62 及び 3.86(全 3 H,s), 4.49-5.19(1H,m), 4.97 及び 5.10(全 2H,s), 6.23-7.53(11H,m)。

【1369】

実施例 497

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.20,2.60-4.55(全 26H,m), 6.45-6.55(1H,m), 6.80-6.95(1 H,m), 6.95-7.60(4H,m), 7.90-8.08(1H,m), 11.8 6(1H,brs)。

【1370】

実施例 498

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.20,2.55-

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.23-5.03 (25 H, m), 1.46 (3 H, t, J=7.0Hz), 4.08 (2 H, q, J=7.0Hz), 6.16 - 7.44 (6 H, m), 12.47 (1 H, brs).

{1365}

Working Example 493

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.11-4.67 (29 H, m), 4.97 - 5.10 (All 2 H, s), 6.22 - 7.51 (11 H, m), 11.43 and 12.04(1 H, m).

{1366}

Working Example 494

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.21-4.62 (26 H, m), 4.98 and 5.11 (All 2 H, s), 6.22 - 7.51 (11 H, m), 8.55 - 8.71(1 H, m), 11.39 - 11.81 (1 H, m).

{1367}

Working Example 495

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.21-4.90 (22 H, m), 1.34 (3 H, t, J=7.3Hz), 4.98 and 5.11 (All 2 H, s), 6.27 - 7.53 (11 H, m),12.48 (1 H, brs).

{1368}

Working Example 496

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.83-3.98 (24 H, m), 2.99 and 3.15 (All 3 H, s), 3.62 and 3.86 (All 3 H, s), 4.49 - 5.19(1 H, m), 4.97 and 5.10 (All 2 H, s), 6.23 - 7.53 (11 H, m).

{1369}

Working Example 497

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-2.20, 2.60-4.55 (All 26 H, m), 6.45 - 6.55 (1 H, m), 6.80 - 6.95 (1 H, m), 6.95 - 7.60 (4 H, m),7.90 - 8.08 (1 H, m), 11.86 (1 H, brs).

{1370}

Working Example 498

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de

3.40,3.40-4.10,4.35-4.53 及び 4.96-5.20(全 26H, m), 6.53(1H,d,J=8Hz), 6.91(1H,dd,J=0.2Hz,J=8 Hz), 7.04(1H,d,J=0.2Hz), 7.13(2H,d,J=8.6Hz), 7.40(2H,d,J=8.6Hz), 12.15(1H,s)。

【1371】

実施例 499

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.20,2.20-3.45,3.45-4.10 及び 4.45-4.65(全 29H,m), 6.50-6.62,6.75-7.55 及び 7.95-8.07(全 7H,m), 11.8-12.2 (1H,m)。

【1372】

実施例 500

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.25-3.40,3.40-4.15 及び 4.40-4.60(全 29H,m), 6.50-6.62,6.80-7.45 及び 7.85-7.95(全 7H,m), 12.06(1H,brs)。

【1373】

実施例 501

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-4.10,4.45-4.60 及び 5.00-5.20(全 29H,m), 6.56(1H,d,J=6.4 Hz), 6.80-7.50(5H,m), 7.96(1H,d,J=8.2Hz), 12.01(1H,brs)。

【1374】

実施例 502

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-4.18 及び 4.50-4.70(全 29H,m), 6.60-6.90,6.90-7.51,7.51-7.66 及び 8.15-8.22(全 7H,m), 11.8-12.25(1H,br)。

【1375】

実施例 503

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.78-3.95,4.42-4.60 及び 5.05-5.21(全 26H,m), 6.49-6.62(1H, m), 6.82-6.98(1H,m), 6.98-7.52(6H,m)。

【1376】

実施例 504

の化合物

ppm :1.20-2.20, 2.55-3.40, 3.40-4.10, 4.35-4.53 and 4.96 - 5.20 (All 26 H, m), 6.53 (1 H, d, J=8Hz), 6.91 (1 H, dd, J=0.2Hz, J=8Hz), 7.04 (1 H, d, J=0.2Hz), 7.13(2 H, d, J=8.6Hz), 7.40 (2 H, d, J=8.6Hz), 12.15 (1 H, s).

{1371}

Working Example 499

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.20-2.20, 2.20-3.45, 3.45-4.10 and 4.45 - 4.65 (All 29 H, m), 6.50 - 6.62 and 6.75 - 7.55 and 7.95 - 8.07 (All 7 H, m), 11.8 - 12.2 (1 H, m).

{1372}

Working Example 500

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.25-3.40, 3.40-4.15 and 4.40 - 4.60 (All 29 H, m), 6.50 - 6.62 and 6.80 - 7.45 and 7.85 - 7.95 (All 7 H, m), 12.06 (1 H, brs).

{1373}

Working Example 501

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.20-4.10, 4.45-4.60 and 5.00 - 5.20 (All 29 H, m), 6.56 (1 H, d, J=6.4Hz), 6.80 - 7.50 (5 H, m), 7.96(1 H, d, J=8.2Hz), 12.01 (1 H, brs).

{1374}

Working Example 502

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.20-4.18 and 4.50 - 4.70 (All 29 H, m), 6.60 - 6.90 and 6.90 - 7.51 and 7.51 - 7.66 and 8.15 - 8.22 (All 7 H, m), 11.8 - 12.25 (1 H, br).

{1375}

Working Example 503

compound

¹H-NHR (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.78-3.95, 4.42-4.60 and 5.05 - 5.21 (All 26 H, m), 6.49 - 6.62 (1 H, m), 6.82 - 6.98 (1 H, m), 6.98 - 7.52 (6 H, m).

{1376}

Working Example 504

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-4.06,4.43-4.64 及び 4.92-5.10(全 26H,m), 6.72-7.65(7H,m), 11.87-12.18(1H,br)。

【1377】

実施例 505

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.00-3.95,4.20-4.44 及び 4.90-5.05(全 22H,m), 5.10-6.50(1H,br), 6.65-6.76(1H,m), 6.90-7.05(1H,m), 7.20-7.35(1H,m), 7.35-7.50(2H,m), 7.70-7.85(2H,m)。

【1378】

実施例 508

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:0.65-0.82,1.00-2.17,2.17-2.95,2.95-3.51,3.55-3.90,4.18-4.35,4.42-4.63,5.03-5.18 及び 5.50-5.75(全 25H,m), 6.51-6.68(1H,m), 6.85-7.45(5H,m), 7.51-7.65(1H,m)。

【1379】

実施例 509

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.49(3H,d,J=6.3Hz), 0.95(3H,d,J=6.3Hz), 1.1-4.2[全 16H,m,3.02(s)],6.55-6.80(3H,m), 7.15-7.45(5H,m)。

【1380】

実施例 510

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.0-2.2,2.4-4.0 及び 4.5-4.6[全 25H,m,2.87(s), 3.0(s)],6.1-7.5[全 7H,m,6.26(dd,J=8.8Hz,J=2.5Hz)]。

【1381】

実施例 511

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-5.35[24H,m,2.33(s)],6.75-8.26(7H,m)。

【1382】

実施例 512

の化合物

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-4.06, 4.43-4.64 and 4.92 - 5.10 (All 26 H, m), 6.72 - 7.65 (7 H, m), 11.87 - 12.18(1 H, br).

{1377}

Working Example 505

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.00-3.95, 4.20-4.44 and 4.90 - 5.05 (All 22 H, m), 5.10 - 6.50 (1 H, br), 6.65 - 6.76 (1 H, m),6.90 - 7.05 (1 H, m), 7.20 - 7.35 (1 H, m), 7.35 - 7.50 (2 H, m), 7.70 - 7.85 (2 H, m).

{1378}

Working Example 508

compound

¹H-NMR (250 MHz , CDCl₃);de ppm :0.65-0.82, 1.00-2.17, 2.17-2.95, 2.95-3.51, 3.55-3.90, 4.18-4.35, 4.42-4.63, 5.03-5.18 and 5.50 - 5.75 (All 25 H, m), 6.51 - 6.68 (1 H, m), 6.85 - 7.45 (5 H, m),7.51 - 7.65 (1 H, m).

{1379}

Working Example 509

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.49 (3 H, d, J=6.3Hz), 0.95 (3 H, d, J=6.3Hz), 1.1 - 4.2 {All 16 H, m, 3.02 (s) }, 6.55 - 6.80 (3 H, m), 7.15 -7.45 (5 H, m).

{1380}

Working Example 510

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.0-2.2, 2.4- 4.0 and 4.5 - 4.6 {All 25 H, m, 2.87 (s), 3.0 (s) }, 6.1 - 7.5 {All 7 H, m, 6.26 (dd, J=8.8Hz , J=2.5Hz) }.

{1381}

Working Example 511

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-5.35 {24 H, m, 2.33 (s) }, 6.75 - 8.26 (7 H, m).

{1382}

Working Example 512

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-1.5,1.5-4.0, 4.4-4.7 及び 4.9-5.1(全 28H,m,2.02(s), 2.18(s)), 6.13-7.70(7H,m)。

【1383】

実施例 516

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.30-1.85,1.85-2.22,2.61-3.16 及び 4.82-5.06(8H,m), 2.50 及び 2.56(全 3H,各 s), 6.55-6.65,6.78-6.95 及び 7.10-7.60(全 8H,m), 8.52-8.70(2H,m)。

【1384】

実施例 517

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.30-2.30,2.30-3.15,3.36-3.60 及び 4.98-5.08[全 11H,m,2.49(s), 2.54(s)],6.60(1H,d,8.4Hz), 6.75-6.95(2H,m), 6.95-7.10(1H,m), 7.10-7.51(5H,m), 8.38-8.87(2H,m)。

【1385】

実施例 520

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:[全 6H,m,0.65 1(d,J=6.5Hz), 1.02(d,J=6.5Hz), 1.15(d,J=6.5Hz, 1.22(d,J=6.5Hz)],1.25-2.22,2.45-2.90,3.00-3.21, 3.50-4.00 及び 4.44-4.67[全 13H,m,2.57(s), 2.63(s)],6.50-7.96 及び 8.65-8.95(11H,m)。

【1386】

実施例 521

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-4.9[全 26 H,m,3.06(s)],6.65-7.75(全 7H,m), 12.4-13.2(1H, m)。

【1387】

実施例 523

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.20,2.29-3.12,3.29-3.61 及び 4.81-5.10[全 21H,m,2.34 (s)],6.23(1H,dd,J=8.72Hz,J=8.73Hz), 6.50(1H,d, J=2.48Hz), 6.56-7.49(5H,m)。

【1388】

All 28 H, m, 2.02 (s), 2.18 (s), 6.13 - 7.70 (7 H, m).

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.1- 1.5, 1.5-4.0, 4.4- 4.7 and 4.9 - 5.1

{1383}

Working Example 516

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.30-1.85, 1.85-2.22, 2.61-3.16 and 4.82 - 5.06 (8 H, m), 2.50 and 2.56 (All 3 H, each s), 6.55 - 6.65 and 6.78 - 6.95 and 7.10 - 7.60 (All 8 H, m), 8.52 - 8.70 (2 H, m).

{1384}

Working Example 517

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.30-2.30, 2.30-3.15, 3.36-3.60 and 4.98 - 5.08 {All 11 H, m, 2.49 (s), 2.54 (s)}, 6.60 (1 H, d, 8.4Hz), 6.75 - 6.95 (2 H, m), 6.95 - 7.10 (1 H, m), 7.10 - 7.51 (5 H, m), 8.38 - 8.87 (2 H, m).

{1385}

Working Example 520

compound

d, J=6.5Hz, 1.22 (d, J=6.5Hz), 1.25 - 2.22 and 2.45 - 2.90 and 3.00 - 3.21 and 3.50 - 4.00 and 4.44 - 4.67 {All 13 H, m, 2.57 (s), 2.63 (s)}, 6.50 - 7.96 and 8.65 - 8.95 (11 H, m). All 6 H, m, 0.651 (d, J=6.5Hz), 1.02 (d, J=6.5Hz), 1.15 ¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :

{1386}

Working Example 521

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.1- 4.9 {All 26 H, m, 3.06 (s)}, 6.65 - 7.75 (All 7 H, m), 12.4 - 13.2 (1 H, m).

{1387}

Working Example 523

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.18-2.20, 2.29-3.12, 3.29-3.61 and 4.81 - 5.10 {All 21 H, m, 2.34 (s)}, 6.23 (1 H, dd, J=8.72Hz, J=8.73Hz), 6.50 (1 H, d, J=2.48Hz), 6.56 - 7.49(5 H, m).

{1388}

実施例 524

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.89(6H,d,J=6.54Hz), 1.32-2.20,2.30-3.31,3.42-3.95 及び 4.82-5.12(全 19H,m), 6.39-7.49(7H,m)。

【1389】

実施例 525

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-2.20 及び 2.20-4.90(全 23H,m), 6.35-6.69,6.69-7.00,7.00-8.34 及び 8.65-9.16(全 10H,m), 1.65-12.8(1H,br)。

【1390】

実施例 526

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.64,0.98,1.16 及び 1.19(全 6H,各 d,J=6.5Hz), 1.20-1.49,1.49-2.23,2.23-4.60 及び 4.95-5.12[全 13H,m,2.58(s), 2.65(s)],6.05-6.50,6.50-6.65,6.70-6.95,7.05-7.45, 7.45-7.90,7.90-8.33 及び 8.75-9.15(全 12H,m)。

【1391】

実施例 529

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-4.88(20H,m), 1.19 及び 1.35(全 9H,s), 2.46,2.49 及び 2.51(全 6H,s), 6.58-7.47(7H,m), 12.76(1H,brs)。

【1392】

実施例 530

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.25,2.36-3.60 及び 4.47-5.09[全 11H,m,2.52(s), 2.58(s)], 6.60-6.75(1H,m), 6.75-7.09(8H,m), 8.52-8.75(2H,m)。

【1393】

実施例 531

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.05-2.0,2.5-4.0 及び 4.2-4.6(全 24H,m), 6.14-7.5[全 7H,m, 6.16(d,J=8.8Hz)],11.1-11.5(2H,m)。

Working Example 524

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃); de ppm :0.89 (6 H, d, J=6.54Hz), 1.32 - 2.20 and 2.30 - 3.31 and 3.42 - 3.95 and 4.82 - 5.12 (All 19 H, m), 6.39 - 7.49 (7 H, m).

{1389}

Working Example 525

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.10-2.20 and 2.20 - 4.90 (All 23 H, m), 6.35 - 6.69 and 6.69 - 7.00 and 7.00 - 8.34 and 8.65 - 9.16 (All 10 H, m), 1.65 - 12.8 (1 H, br).

{1390}

Working Example 526

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃); de ppm :0.64, 0.98, 1.16 and 1.19 (All 6 H, each d, J=6.5Hz), 1.20 - 1.49 and 1.49 - 2.23 and 2.23 - 4.60 and 4.95 - 5.12 {All 13 H, m, 2.58 (s), 2.65 (s) }, 6.05 - 6.50 and 6.50 - 6.65 and 6.70 - 6.95 and 7.05 - 7.45 and 7.45 - 7.90 and 7.90 - 8.33 and 8.75 - 9.15 (All 12 H, m).

{1391}

Working Example 529

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.13-4.88 (20 H, m), 1.19 and 1.35 (All 9 H, s), 2.46 and 2.49 and 2.51(All 6 H, s), 6.58 - 7.47 (7 H, m), 12.76 (1 H, brs).

{1392}

Working Example 530

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.35-2.25, 2.36-3.60 and 4.47 - 5.09 {All 11 H, m, 2.52 (s), 2.58 (s) }, 6.60 - 6.75 (1 H, m), 6.75 - 7.09 (8 H, m), 8.52 - 8.75 (2 H, m).

{1393}

Working Example 531

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆); de ppm :1.05-2.0, 2.5-4.0 and 4.2 - 4.6 (All 24 H, m), 6.14 - 7.5 {All 7 H, m, 6.16 (d, J=8.8Hz) }, 11.1 -

6.16(d,J=8.8Hz)],11.1-11.5(2H,m)。

【1394】

実施例 532

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.3-2.4,2.7-4.1, 4.5-4.7 及び 5.0-5.2(全 9H,m), 6.7-7.8(12H,m)。

【1395】

実施例 534

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.30-2.25,2.40-3.50 及び 4.86-5.08[全 11H,m,2.53(s), 2.58(s)], 6.00-7.60 及び 8.55-8.85(全 10H,m)。

【1396】

実施例 535

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-4.90(23H,m), 6.50-6.66,6.80-7.68 及び 8.60-8.91(全 9H,m), 12.77-13.45(1H,br)。

【1397】

実施例 541

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.00-2.11, 2.12-3.90 及び 4.18-4.71[全 34H,m,2.32(s), 2.36(s)],6.40-7.55(6H,m), 9.82-10.16 及び 10.80-11.24(全 1H,m)。

【1398】

実施例 542

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.15,2.6-3.15,3.65-4.0,4.47,4.57 及び 4.85-5.0[全 16H,m, 4.47(s), 4.57(s)],6.48 及び 6.7-7.45[全 12H,m,6.48(s)]。

【1399】

実施例 544

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-4.92(20H,m), 2.53 及び 2.59(全 3H,s), 6.54-6.75(1H,m), 6.91-7.18(2H,m), 7.23-7.68(8H,m), 12.83(1H,br s)。

11.5 (2 H, m).

{1394}

Working Example 532

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.3- 2.4, 2.7-4.1, 4.5-4.7 and 5.0 - 5.2 (All 9 H, m), 6.7 - 7.8 (12 H, m).

{1395}

Working Example 534

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.30-2.25, 2.40-3.50 and 4.86 - 5.08 {All 11 H, m, 2.53 (s), 2.58 (s) }, 6.00 - 7.60 and 8.55 - 8.85 (All 10 H, m).

{1396}

Working Example 535

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-4.90 (23 H, m), 6.50 - 6. 66 and 6. 80 - 7.68 and 8.60 - 8.91(All 9 H, m), 12.77 - 13.45 (1 H, br).

{1397}

Working Example 541

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.00-2.11, 2.12-3.90 and 4.18 - 4.71 {All 34 H, m, 2.32 (s), 2.36 (s) }, 6.40 - 7.55 (6 H, m), 9.82 - 10.16and 10.80 - 11.24 (All 1 H, m).

{1398}

Working Example 542

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-2.15, 2.6-3.15, 3.65-4.0, 4.47, 4.57 and 4.85 - 5.0 {All 16 H, m, 4.47 (s), 4.57 (s) }, 6.48 and 6.7 - 7.45 {All 12 H, m, 6.48 (s) }.

{1399}

Working Example 544

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-4.92 (20 H, m), 2.53 and 2.59 (All 3 H, s), 6.54 - 6.75 (1 H, m), 6.91 - 7.18(2 H, m), 7.23 - 7.68 (8 H, m), 12.83 (1 H, brs).

【1400】

実施例 545

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-5.20(20H, m), 4.93 及び 5.11(全 2H,s), 6.53-7.56(12H,m), 12.34-13.15(1H,m)。

【1401】

実施例 547

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.82-5.25(27H, m), 3.87(2H,t,J=6.4Hz), 6.53-6.80(2H,m), 6.83-7.68(6H,m), 12.32-13.22(1H,m)。

【1402】

実施例 553

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-4.21,4.49-4.71 及び 4.98-5.20(全 25H,m), 6.28-7.61(11H, m)。

【1403】

実施例 554

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-4.04,4.48-4.71 及び 4.97-5.19[全 26H,m,2.17(s), 2.21(s)], 6.42-7.74(12H,m)。

【1404】

実施例 555

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.57(4H,t,J=5.10Hz), 3.32(4H,t,J=5.10Hz), 3.56(2H,s), 3.86(3 H,s), 6.74(1H,dd,J=8.94Hz,J=8.96Hz), 6.85(1H, d,J=2.55Hz), 7.25-7.45(5H,m), 7.83(1H,d,J=8.91Hz)。

【1405】

実施例 556

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03-2.22,2.60-3.15,3.90-4.28 及び 4.80-5.00[全 28H,m,1.45(s), 3.98(d,J=6.31Hz)],6.68-7.42 及び 7.58-7.71(全 7H,m)。

【1406】

{1400}

Working Example 545

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.17-5.20 (20 H, m), 4.93 and 5.11 (All 2 H, s), 6.53 - 7.56 (12 H, m), 12.34 - 13.15(1 H, m).

{1401}

Working Example 547

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.82-5.25 (27 H, m), 3.87 (2 H, t, J=6.4Hz), 6.53 - 6.80 (2 H, m), 6.83 - 7.68 (6 H, m), 12.32- 13.22 (1 H, m).

{1402}

Working Example 553

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.11-4.21, 4.49-4.71 and 4.98 - 5.20 (All 25 H, m), 6.28 - 7.61 (11 H, m).

{1403}

Working Example 554

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-4.04, 4.48-4.71 and 4.97 - 5.19 {All 26 H, m, 2.17 (s), 2.21 (s) }, 6.42 - 7.74 (12 H, m).

{1404}

Working Example 555

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.57 (4 H, t, J=5.10Hz), 3.32 (4 H, t, J=5.10Hz), 3.56 (2 H, s), 3.86 (3 H, s), 6.74 (1 H, dd, J=8.94Hz , J=8.96Hz), 6.85 (1 H, d, J=2.55Hz),7.25 - 7.45 (5 H, m), 7.83 (1 H, d, J=8.91Hz).

{1405}

Working Example 556

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.03-2.22, 2.60-3.15, 3.90-4.28 and 4.80 - 5.00 {All 28 H, m, 1.45 (s), 3.98 (d, J=6.31 Hz) }, 6.68 - 7.42 and 7.58 - 7.71 (All 7 H, m).

{1406}

実施例 558

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz,DMSO- d_6) δ ppm:0.9-2.2,2.6-3.2 及び 4.5-4.9[全 15H,m,4.51(s), 4,58(s)], 6.8-7.15,7.15-7.40 及び 7.40-7.90(全 12.2H,m), 8.47 及び 8.7(全 0.8H,各 s)。

【1407】

実施例 559

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:0.80-4.08 及び 4.42-4.69[全 29H,m,2.40(s)],6.58-7.78[全 8H,m,7.51(d,J=2.01Hz)]。

【1408】

実施例 560

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:1.0-1.25,1.25-2.25,2.5-3.7 及び 4.4-5.0(全 15H,m), 6.73-7.75(全 10H,m), 8.53(2H,d,J=5Hz)。

【1409】

実施例 562

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:1.17-4.86(26H,m), 6.50-7.65(10H,m), 12.67(1H,brs)。

【1410】

実施例 563

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz,DMSO- d_6) δ ppm:0.96-2.35 及び 2.36-4.97(全 20H,m), 6.79-8.06(12H,m), 10.02-10.46 及び 11.00-11.60(全 1H,m)。

【1411】

実施例 564

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:0.52-2.22,2.23-4.24,4.34-4.71 及び 4.91-5.17[全 14H,m,0.66(t,J=7.3Hz)],5.53-5.74 及び 6.29-6.58(全 1H,m), 6.89-7.88(12H,m)。

【1412】

Working Example 558

compound

$^1\text{H-nmr}$ (200 MHz , DMSO- d_6); δ ppm :0.9-2.2, 2.6-3.2 and 4.5 - 4.9 {All 15 H, m, 4.51 (s) , 4 and 58 (s) }, 6.8 - 7.15 and 7.15 - 7.40 and 7.40 - 7.90 (All 12.2 H, m) , 8.47 and 8.7 (All 0.8 H, each s) .

{1407}

Working Example 559

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz , CDCl_3); δ ppm :0.80-4.08 and 4.42 - 4.69 {All 29 H, m, 2.40 (s) }, 6.58 - 7.78 {All 8 H, m, 7.51 (d, J=2.01Hz) } .

{1408}

Working Example 560

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz , CDCl_3); δ ppm :1.0-1.25, 1.25-2.25, 2.5-3.7 and 4.4 - 5.0 (All 15 H, m) , 6.73 - 7.75 (All 10 H, m) , 8.53 (2 H, d, J=5Hz) .

{1409}

Working Example 562

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz , CDCl_3); δ ppm :1.17-4.86 (26 H, m) , 6.50 - 7.65 (10 H, m) , 12.67 (1 H, brs) .

{1410}

Working Example 563

compound

$^1\text{H-nmr}$ (200 MHz , DMSO- d_6); δ ppm :0.96-2.35 and 2.36 - 4.97 (All 20 H, m) , 6.79 - 8.06 (12 H, m) , 10.02 - 10.46 and 11.00 - 11.60 (All 1 H, m) .

{1411}

Working Example 564

compound

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz , CDCl_3); δ ppm :0.52-2.22, 2.23-4.24, 4.34-4.71 and 4.91 - 5.17 {All 14 H, m, 0.66 (t, J=7.3Hz) } , 5.53 - 5.74 and 6.29 - 6.58 (All 1 H, m) , 6.89 - 7.88 (12 H, m) .

{1412}

実施例 565

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.08-2.21, 2.23-4.08 及び 4.21-5.11[全 26H,m,2.31(s), 2.44(s)],6.46-7.78(11H,m), 10.00-10.28 及び 10.96-11.45(全 1H,m)。

【1413】

実施例 566

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-2.20,2.28-4.10,4.42-4.71 及び 4.89-5.11[全 25H,m,2.42(s), 2.56(s)],6.59-7.68(11H,m)。

【1414】

実施例 567

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.79-2.19, 2.29-3.80 及び 3.96-4.67(全 23H,m), 6.52-7.48 及び 7.49-8.45(11H,m), 9.83-10.21 及び 10.86-11.51(全 1H,各 br)。

【1415】

実施例 572

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.57-0.90,1.03-2.22,2.27-4.69 及び 5.49-5.71[全 20H,m,0.67(t,J=7.3Hz), 2.44(s), 2.59(s)],5.49-5.71 及び 6.36-7.65(全 12H,m)。

【1416】

実施例 577

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.3-2.2,2.65-3.2,4.0-4.4 及び 4.8-5.0(全 11H,m), 6.18(1H,dd,J=8.4Hz,J=2.4Hz), 6.48(1H,d,J=2.2Hz), 6.69(1H,d,J=8.4Hz), 6.85-7.45(9H,m)。

【1417】

実施例 578

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.2,2.5-3.4, 4.15-4.4 及び 4.7-5.1(全 14H,m), 6.15(0.88H,d,J=8Hz), 6.43(0.94H,s), 6.67(1.07H,d,J=8Hz), 6.8-7.5(9.1H,m)。

【1418】

Working Example 565

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.08-2.21, 2.23-4.08 and 4.21 - 5.11 {All 26 H, m, 2.31 (s) , 2.44 (s) } , 6.46 - 7.78 (11 H, m) , 10.00 - 10.28and 10.96 - 11.45 (All 1 H, m) .

{1413}

Working Example 566

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-2.20, 2.28-4.10, 4.42-4.71 and 4.89 - 5.11 {All 25 H, m, 2.42 (s) , 2.56 (s) } , 6.59 - 7.68 (11 H, m) .

{1414}

Working Example 567

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.79-2.19, 2.29-3.80 and 3.96 - 4.67 (All 23 H, m) , 6.52 - 7.48 and 7.49 - 8.45 (11 H, m) ,9.83 - 10.21 and 10.86 - 11.51 (All 1 H, each br) .

{1415}

Working Example 572

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.57-0.90, 1.03-2.22, 2.27-4.69 and 5.49 - 5.71 {All 20 H, m, 0.67 (t, J=7.3Hz) , 2.44 (s) , 2.59 (s) } , 5.49 - 5.71 and 6.36 - 7.65 (All 12 H, m) .

{1416}

Working Example 577

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.3- 2.2, 2.65-3.2, 4.0-4.4 and 4.8 - 5.0 (All 11 H, m) , 6.18 (1 H, dd, J=8.4Hz , J=2.4Hz) , 6.48 (1 H, d, J=2.2Hz) , 6.69 (1 H, d, J=8.4Hz) , 6.85 -7.45 (9 H, m) .

{1417}

Working Example 578

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.2- 2.2, 2.5-3.4, 4.15-4.4 and 4.7 - 5.1 (All 14 H, m) , 6.15 (0.88 H, d, J=8Hz) , 6.43 (0.94 H, s) , 6.67 (1.07 H, d, J=8Hz) , 6.8 -7.5 (9.1 H, m) .

{1418}

実施例 583

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.95-4.9[全 26 H,m,1.10(t,J=7.2Hz), 2.47(d,J=4Hz)],6.8-7.2,7.2-7.55,7.55-8.25 及び 8.25-8.60[全 14H,m,8.44 (s)]。

【1419】

実施例 584

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.666(3H,t,J=7.3Hz), 1.50-4.00(17H,m), 6.40-7.20(13H,m)。

【1420】

実施例 585

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.00-4.20 及び 4.40-4.35[全 23H,m,2.50(s), 2.54(s)],6.80-7.65 (12H,m)。

【1421】

実施例 586

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.45-3.13,3.20-4.00 及び 4.20-5.18(全 13H,m), 6.62-7.66(12H,m)。

【1422】

実施例 589

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.8-3.7 及び 4.85-5.15[全 24H,m,2.37(s)],5.9-7.2[全 7H,m,6.27 (s)]。

【1423】

実施例 593

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.3-3.8,4.2-4.8 及び 4.9-5.15[全 12H,m,3.36(s), 3.48(s), 4.55 (s)],6.6-7.95(12H,m), 8.15-8.7(1H,m)。

【1424】

実施例 594

の化合物

Working Example 583

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.95-4.9 {All 26 H, m, 1.10 (t, J=7.2Hz), 2.47 (d, J=4Hz) }, 6.8 - 7.27.2 - 7.55 and 7.55 - 8.25 and 8.25 - 8.60 {All 14 H, m, 8.44 (s) }.

{1419}

Working Example 584

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.666 (3 H, t, J=7.3Hz), 1.50 - 4.00 (17 H, m), 6.40 - 7.20 (13 H, m).

{1420}

Working Example 585

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.00-4.20 and 4.40 - 4.35 {All 23 H, m, 2.50 (s), 2.54 (s) }, 6.80 - 7.65 (12 H, m).

{1421}

Working Example 586

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.45-3.13, 3.20-4.00 and 4.20 - 5.18 (All 13 H, m), 6.62 - 7.66 (12 H, m).

{1422}

Working Example 589

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.8-3.7 and 4.85 - 5.15 {All 24 H, m, 2.37 (s) }, 5.9 - 7.2 {All 7 H, m, 6.27 (s) }.

{1423}

Working Example 593

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.3- 3.8, 4.2- 4.8 and 4.9 - 5.15 {All 12 H, m, 3.36 (s), 3.48 (s), 4.55 (s) }, 6.6 - 7.95 (12 H, m), 8.15 - 8.7 (1 H, m).

{1424}

Working Example 594

compound

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-2.35,2.60-3.15,3.75-4.20,4.30-4.61 及び 4.79-5.11(全 12H, m), 6.71-7.75(7H,m)。

【1425】

実施例 595

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-3.30,3.30-4.18 及び 4.40-4.62(全 20H,m), 6.55-6.72(1H, m), 6.72-6.97(2H,m), 6.97-7.18(2H,m), 7.18-7.67(7H,m)。

【1426】

実施例 599

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-1.58,1.58-4.29 及び 4.50-4.85[全 25H,m,1.71(s), 2.54(s)], 7.05-7.72(12H,m), 14.5-17.8(1H,brs)。

【1427】

実施例 601

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.50-2.20,2.20-2.73 及び 2.90-4.00[全 16H,m,1.62(s), 2.59(s), 3.24(s)],7.16-7.69(12H,m), 9.42(1H,s)。

【1428】

実施例 606

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.00,2.55-2.90,3.35-3.70 及び 4.40-4.60[全 27H,m,1.57(s)],7.00-7.34(3H,m)。

【1429】

実施例 607

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.09,2.56-2.97,3.30-3.65,4.40-4.60 及び 4.71-4.82(全 24H, m), 6.95-7.28(3H,m)。

【1430】

実施例 608

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.15-1.55, 1.70-2.35,2.55-3.16,3.44-3.65,4.20-4.40 及び 4.7 0-5.07(全 9H,m), 6.49-6.57,6.57-6.85,6.9-7.05 及び 7.05-7.5(全 8H,m), 7.62-7.75(2H,m)。

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.19-2.35, 2.60-3.15, 3.75-4.20, 4.30-4.61 and 4.79 - 5.11 (All 12 H, m), 6.71 - 7.75 (7 H, m).

{1425}

Working Example 595

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.75-3.30, 3.30-4.18 and 4.40 - 4.62 (All 20 H, m), 6.55 - 6.72 (1 H, m), 6.72 - 6.97 (2 H, m),6.97 - 7.18 (2 H, m), 7.18 - 7.67 (7 H, m).

{1426}

Working Example 599

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-1.58, 1.58-4.29 and 4.50 - 4.85 {All 25 H, m, 1.71 (s), 2.54 (s) }, 7.05 - 7.72 (12 H, m), 14.5 - 17.8 (1 H, brs).

{1427}

Working Example 601

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.50-2.20, 2.20-2.73 and 2.90 - 4.00 {All 16 H, m, 1.62 (s), 2.59 (s), 3.24 (s) }, 7.16 - 7.69 (12 H, m), 9.42 (1 H, s).

{1428}

Working Example 606

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.00, 2.55-2.90, 3.35-3.70 and 4.40 - 4.60 {All 27 H, m, 1.57 (s) }, 7.00 - 7.34 (3 H, m).

{1429}

Working Example 607

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.09, 2.56-2.97, 3.30-3.65, 4.40-4.60 and 4.71 - 4.82 (All 24 H, m), 6.95 - 7.28 (3 H, m).

{1430}

Working Example 608

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.15-1.55, 1.70-2.35, 2.55-3.16, 3.44-3.65, 4.20-4.40 and 4.70 - 5.07 (All 9 H, m), 6.49 - 6.57 and 6.57 - 6.85, 6.9 - 7.05 and 7.05 - 7.5 (All 8 H, m), 7.62 -

び 7.05-7.5(全 8H,m), 7.62-7.75(2H,m)。

【1431】

実施例 609

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.15-2.14, 2.14-4.40 及び 4.90-5.54(全 12H,m), 6.65 及び 6.72(全 1H,各 d,J=8.3Hz), 6.92-7.46 及び 7.60-7.81(全 8H,m)。

【1432】

実施例 610

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.15-2.63,2.27-3.18,3.55-4.06 及び 5.82-6.03(全 8H,m), 7.46(1 H,d,8.3Hz), 7.78(1H,dd,J=2.4Hz,J=8.3Hz), 8.16(1H,d,J=2.4Hz), 8.21-8.33(2H,m), 8.54-8.70(2 H,m), 10.87(1H,s)。

【1433】

実施例 611

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.49-1.76,1.86-2.22,2.67-3.09 及び 4.90-5.08(全 8H,m), 6.51(1 H,d,J=8.3Hz), 6.89(1H,dd,J=2Hz,J=8.3Hz), 7.13-7.35(3H,m), 7.42-7.56(2H,m)。

【1434】

実施例 613

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.27-1.70,1.80-2.30,2.68-3.37,3.40-3.85,4.35-4.58 及び 5.08-5.20(全 9H,m), 6.47 及び 6.54(全 1H,各 d,J=8.3Hz), 6.86-7.01(1H,m), 7.15 及び 7.32(全 1H,各 d,J=2Hz), 7.35-7.56(4H,m)。

【1435】

実施例 614

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-3.90,4.40-4.55 及び 5.03-5.20(全 28H,m), 6.45-6.65(1H, m), 6.70-7.35(6H,m), 7.65-7.95(1H,m)。

【1436】

実施例 615

の化合物

7.75 (2 H, m) .

{1431}

Working Example 609

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.15-2.14, 2.14-4.40 and 4.90 - 5.54 (All 12 H, m), 6.65 and 6.72 (All 1 H, each d, J=8.3Hz), 6.92 - 7.46and 7.60 - 7.81 (All 8 H, m) .

{1432}

Working Example 610

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.15-2.63, 2.27-3.18, 3.55-4.06 and 5.82 - 6.03 (All 8 H, m), 7.46 (1 H, d, 8.3Hz), 7.78 (1 H, dd, J=2.4Hz , J=8.3Hz), 8.16 (1 H, d, J=2.4Hz), 8.21- 8.33 (2 H, m), 8.54 - 8.70 (2 H, m), 10.87 (1 H, s) .

{1433}

Working Example 611

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.49-1.76, 1.86-2.22, 2.67-3.09 and 4.90 - 5.08 (All 8 H, m), 6.51 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.89 (1 H, dd, J=2Hz , J=8.3Hz), 7.13 - 7.35(3 H, m), 7.42 - 7.56 (2 H, m) .

{1434}

Working Example 613

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.27-1.70, 1.80-2.30, 2.68-3.37, 3.40-3.85, 4.35-4.58 and 5.08 - 5.20 (All 9 H, m), 6.47 and 6.54 (All 1 H, each d, J=8.3Hz), 6.86 - 7.01(1 H, m), 7.15 and 7.32 (All 1 H, each d, J=2Hz), 7.35 - 7.56 (4 H, m) .

{1435}

Working Example 614

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.75-3.90, 4.40-4.55 and 5.03 - 5.20 (All 28 H, m), 6.45 - 6.65 (1 H, m), 6.70 - 7.35 (6 H, m),7.65 - 7.95 (1 H, m) .

{1436}

Working Example 615

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.80-3.90,4.35-4.56,5.08-5.20 及び 6.45-6.67(1H,m), 6.90-7.55(6H,m), 7.80-8.25 及び 8.75-8.85(全 1H,m)。

【1437】

実施例 616

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.00-3.95,4.37-4.57 及び 5.00-5.17(全 22H,m), 6.45 及び 6.50(全 1H,各 d,J=8.3Hz), 6.90(1H,dd,J=2.3Hz,J=8.3Hz), 6.96-7.06 及び 7.29-7.36(全 2H,m), 7.44-7.68(4H,m)。

【1438】

実施例 617

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.85-3.92,4.35-4.52 及び 4.95-5.15(全 26H,m), 6.40-6.55(1H,m), 6.85-6.95(1H,m), 6.95-7.15(1H,m), 7.30-7.70(4H,m)。

【1439】

実施例 618

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.20,2.52-3.90,4.40-4.59 及び 5.08-5.26(全 22H,m), 6.54-6.68(1H,m), 6.87-7.44(6H,m)。

【1440】

実施例 619

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.21,2.47-3.01,3.07-3.32,3.41-3.78,4.35-4.57 及び 5.08-5.23(全 19H,m), 6.00-6.51(1H,brs), 6.59(1H,d,J=8.3Hz), 6.89-7.41(6H,m)。

【1441】

実施例 622

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.76-2.21,2.22-4.31,4.38-4.64 及び 5.01-5.24[全 23H,m,2.41(s), 2.46(s)],6.38-7.43(6H,m)。

【1442】

実施例 623

の化合物

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.80-3.90, 4.35-4.56, 5.08-5.20 and 6.45 - 6.67 (1 H, m), 6.90 - 7.55 (6 H, m), 7.80 - 8.25and 8.75 - 8.85 (All 1 H, m).

{1437}

Working Example 616

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.00-3.95, 4.37-4.57 and 5.00 - 5.17 (All 22 H, m), 6.45 and 6.50 (All 1 H, each d, J=8.3Hz), 6.90 (1 H, dd, J=2.3Hz , J=8.3Hz), 6.96- 7.06 and 7.29 - 7.36 (All 2 H, m), 7.44 - 7.68 (4 H, m).

{1438}

Working Example 617

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.85-3.92, 4.35-4.52 and 4.95 - 5.15 (All 26 H, m), 6.40 - 6.55 (1 H, m), 6.85 - 6.95 (1 H, m),6.95 - 7.15 (1 H, m), 7.30 - 7.70 (4 H, m).

{1439}

Working Example 618

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.20, 2.52-3.90, 4.40-4.59 and 5.08 - 5.26 (All 22 H, m), 6.54 - 6.68 (1 H, m), 6.87 - 7.44(6 H, m).

{1440}

Working Example 619

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.21, 2.47-3.01, 3.07-3.32, 3.41-3.78, 4.35-4.57 and 5.08 - 5.23 (All 19 H, m), 6.00 - 6.51 (1 H, brs), 6.59 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.89 -7.41 (6 H, m).

{1441}

Working Example 622

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.76-2.21, 2.22-4.31 , 4.38-4.64 and 5.01 - 5.24 {All 23 H, m, 2.41 (s), 2.46 (s) }, 6.38 - 7.43 (6 H, m).

{1442}

Working Example 623

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.73-5.18(24 H,m), 6.52-8.03(8H,m), 12.50-13.30(1H,m)。

【1443】

実施例 624

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.93(3H,t,J=7.2 Hz), 1.10-2.30(8H,m), 2.56-4.30(5H,m), 3.65 及び 3.70(全 3H,s), 3.88(2H,t,J=6.5Hz), 4.38-5.33(1H,m), 6.51-7.40(8H,m)。

【1444】

実施例 626

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.22(4H, m), 2.40-5.23(5H,m), 2.52 及び 2.56(全 3H,s), 3.72 及び 3.73(全 3H,s), 6.45-7.70(10H,m)。

【1445】

実施例 627

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-2.21(4H, m), 2.61-3.02(2H,m), 3.09-3.85(1H,m), 3.69(3 H,s), 4.01-4.27(1H,m), 4.43-5.18(1H,m), 4.94 及び 5.10(全 2H,s), 6.46-6.67(1H,m), 6.83-7.50 (1H,m)。

【1446】

実施例 629

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.09-2.32(4H, m), 2.56-5.33(5H,m), 3.69 及び 3.74(全 3H,s), 6.53-7.78(12H,m)。

【1447】

実施例 630

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.18(4H, m), 1.18 及び 1.34(全 9H,s), 2.33-5.24(5H,m), 2.45 及び 2.49(全 3H,s), 7.32(3H,s), 6.43-7.51(7 H,m)。

【1448】

実施例 631

の化合物

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) δ ppm:0.73-5.18 (24 H, m), 6.52 - 8.03 (8 H, m), 12.50 - 13.30 (1 H, m).

{1443}

Working Example 624

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃) δ ppm:0.93 (3 H, t, J=7.2Hz), 1.10 - 2.30 (8 H, m), 2.56 - 4.30 (5 H, m), 3.65 and 3.70(All 3 H, s), 3.88 (2 H, t, J=6.5Hz), 4.38 - 5.33 (1 H, m), 6.51 - 7.40 (8 H, m).

{1444}

Working Example 626

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃) δ ppm:1.20-2.22 (4 H, m), 2.40 - 5.23 (5 H, m), 2.52 and 2.56 (All 3 H, s), 3.72 and 3.73(All 3 H, s), 6.45 - 7.70 (10 H, m).

{1445}

Working Example 627

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃) δ ppm:1.17-2.21 (4 H, m), 2.61 - 3.02 (2 H, m), 3.09 - 3.85 (1 H, m), 3.69 (3 H, s), 4.01 -4.27 (1 H, m), 4.43 - 5.18 (1 H, m), 4.94 and 5.10 (All 2 H, s), 6.46 - 6.67 (1 H, m), 6.83 - 7.50(11 H, m).

{1446}

Working Example 629

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃) δ ppm:1.09-2.32 (4 H, m), 2.56 - 5.33 (5 H, m), 3.69 and 3.74 (All 3 H, s), 6.53 - 7.78(12 H, m).

{1447}

Working Example 630

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃) δ ppm:1.12-2.18 (4 H, m), 1.18 and 1.34 (All 9 H, s), 2.33 - 5.24 (5 H, m), 2.45 and 2.49(All 3 H, s), 7.32 (3 H, s), 6.43 - 7.51 (7 H, m).

{1448}

Working Example 631

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-2.25(4H, m), 1.18 及び 1.33(全 9H,s), 2.34-3.96(5H,m), 2.45 及び 2.50(全 3H,s), 6.47-7.50(7H,m), 9.00 (1H,brs)。

【1449】

実施例 632

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.35(7H, m), 2.58-3.28(3H,m), 3.35-5.20(10H,m), 6.15-7.56(6H,m)。

【1450】

実施例 633

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-2.22(7H, m), 2.58-3.29(3H,m), 3.35-4.18(6H,m), 4.45-5.21(1H,m), 6.12-7.48(6H,m), 10.82(1H,brs)。

【1451】

実施例 634

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.13-2.21(4 H,m), 2.36-4.31(4H,m), 2.49(3H,s), 4.33-5.13 (1H,m), 6.76-7.88(11H,m), 12.43(1H,brs)。

【1452】

実施例 637

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.33,2.33-3.99,3.99-4.31,4.50-4.65 及び 5.05-5.18(全 15H, m), 6.50-7.70 及び 8.10-8.20(全 12H,m)。

【1453】

実施例 640

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.26,2.35-3.90,4.43-4.66 及び 5.03-5.22(全 15H,m), 6.40-6.70(1H,m), 6.73-6.95(1H,m), 6.95-7.65(6H,m), 8.50-8.75(2H,m)。

【1454】

実施例 641

の化合物

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.08-2.25 (4 H, m), 1.18 and 1.33 (All 9 H, s), 2.34 - 3.96 (5 H, m), 2.45 and 2.50(All 3 H, s), 6.47 - 7.50 (7 H, m), 9.00 (1 H, brs).

{1449}

Working Example 632

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.35 (7 H, m), 2.58 - 3.28 (3 H, m), 3.35 - 5.20 (10 H, m), 6.15 - 7.56 (6 H, m).

{1450}

Working Example 633

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-2.22 (7 H, m), 2.58 - 3.29 (3 H, m), 3.35 - 4.18 (6 H, m), 4.45 - 5.21 (1 H, m),6.12 - 7.48 (6 H, m), 10.82 (1 H, brs).

{1451}

Working Example 634

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.13-2.21 (4 H, m), 2.36 - 4.31 (4 H, m), 2.49 (3 H, s), 4.33 - 5.13 (1 H, m), 6.76 -7.88 (11 H, m), 12.43 (1 H, brs).

{1452}

Working Example 637

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.33, 2.33-3.99, 3.99-4.31 , 4.50-4.65 and 5.05 - 5.18 (All 15 H, m), 6.50 - 7.70 and 8.10 - 8.20 (All 12 H, m).

{1453}

Working Example 640

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.13-2.26, 2.35-3.90, 4.43-4.66 and 5.03 - 5.22 (All 15 H, m), 6.40 - 6.70 (1 H, m), 6.73 - 6.95 (1 H, m),6.95 - 7.65 (6 H, m), 8.50 - 8.75 (2 H, m).

{1454}

Working Example 641

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.22-2.35,2.5-3.3,3.4-3.9,4.35-4.7 及び 5.0-5.3(全 18H,m), 6.65(1H,d,J=8.3Hz), 6.85-7.5(9H,m), 7.6-7.8(1H,m)。

【1455】

実施例 642

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-1.65,1.9-2.25,2.6-3.1,3.1-3.35,3.4-3.75,4.3-4.6 及び 4.9-5.6(全 14H,m), 6.62(1H,d,J=8.3Hz), 6.85-7.5(9H,m), 7.6-7.8(1H,m)。

【1456】

実施例 643

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.78-1.06,1.14-2.19,2.59-3.30,3.40-4.65 及び 4.94-5.16[全 21H,m,3.69(s)],6.78-7.75 及び 8.56-8.70[全 8H,m,7.45(s)]。

【1457】

実施例 644

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.92(6H,d,J=6.71Hz), 1.19-2.32,2.55-4.62 及び 4.95-5.16(全 12 H,m), 6.32-7.95[全 9H,m,7.55(s)]。

【1458】

実施例 645

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.31,2.52-4.70 及び 4.90-5.15[全 14H,m,3.69(s)],6.79-7.81 及び 8.55-8.72(全 8H,m)。

【1459】

実施例 646

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.35,2.62-4.71 及び 4.98-5.19[全 16H,m,3.70(s)],6.81-7.92 [全 7H,m,7.52(d,J=2.06Hz)]。

【1460】

実施例 649

の化合物

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.22-2.35, 2.5-3.3, 3.4- 3.9, 4.35-4.7 and 5.0 - 5.3 (All 18 H, m), 6.65 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.85 - 7.5 (9 H, m), 7.6 - 7.8(1 H, m).

{1455}

Working Example 642

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.2- 1.65, 1.9-2.25, 2.6-3.1, 3.1- 3.35, 3.4- 3.75, 4.3- 4.6 and 4.9 - 5.6 (All 14 H, m), 6.62 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.85 - 7.5 (9 H, m), 7.6 - 7.8(1 H, m).

{1456}

Working Example 643

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.78-1.06, 1.14-2.19, 2.59-3.30, 3.40-4.65 and 4.94 - 5.16 {All 21 H, m, 3.69 (s) }, 6.78 - 7.75 and 8.56 - 8.70 {All 8 H, m, 7.45 (s) }.

{1457}

Working Example 644

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.92 (6 H, d, J=6.71Hz), 1.19 - 2.32 and 2.55 - 4.62 and 4.95 - 5.16(All 12 H, m), 6.32 - 7.95 {All 9 H, m, 7.55 (s) }.

{1458}

Working Example 645

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.31 , 2.52-4.70 and 4.90 - 5.15 {All 14 H, m, 3.69 (s) }, 6.79 - 7.81 and 8.55 - 8.72 (All 8 H, m).

{1459}

Working Example 646

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.13-2.35, 2.62-4.71 and 4.98 - 5.19 {All 16 H, m, 3.70 (s) }, 6.81 - 7.92 {All 7 H, m, 7.52 (d, J=2.06Hz) }.

{1460}

Working Example 649

compound

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.98-4.60 及び 4.78-4.90(全 13H,m), 6.05-6.21 及び 6.40-8.08(全 7H,m)。

【1461】

実施例 647

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.25-2.32,2.60-3.31,3.40-4.68 及び 5.05-5.20[全 18H,m,3.69(s)],6.58-7.81(8H,m)。

【1462】

実施例 648

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-2.32,2.58-3.90,4.00-4.68 及び 5.00-5.18[全 18H,m,3.70(s)],6.80-7.64(7H,m)。

【1463】

実施例 650

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.89(2H,t,J=6Hz), 4.35(2H,t,J=6Hz), 7.0(1H,d,J=7Hz), 7.2-7.7(10H,m), 7.99(1H,d,J=2.5Hz)。

【1464】

実施例 651

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.33(3H,t,J=7Hz), 3.44(2H,dt,J=6.4Hz,J=2.4Hz), 3.98(2H,t,J=6.4Hz), 4.23(2H,q,J=7Hz), 6.41(1H,t,J=2.4Hz), 6.86(1H,d,J=8.6Hz), 7.0(1H,dd,J=8.4Hz,J=2.4Hz), 7.35-7.70(10H,m)。

【1465】

実施例 652

の化合物

¹H-NHR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.29(3H,t,J=7Hz), 1.8-2.3(2H,m), 2.6-2.8(1H,m), 2.8-3.0(1H,m), 3.3-3.56(1H,m), 3.85-4.1(2H,m), 4.22(2H,q,J=7Hz), 6.69(1H,d,J=8.6Hz), 6.89(1H,dd,J=8.6Hz,J=2.4Hz), 7.2-7.7(10H,m)。

【1466】

実施例 653

の化合物

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.98-4.60 and 4.78 - 4.90 (All 13 H, m), 6.05 - 6.21 and 6.40 - 8.08 (All 7 H, m).

{1461}

Working Example 647

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.25-2.32, 2.60-3.31 , 3.40-4.68 and 5.05 - 5.20 {All 18 H, m, 3.69 (s) }, 6.58 - 7.81 (8 H, m).

{1462}

Working Example 648

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05-2.32, 2.58-3.90, 4.00-4.68 and 5.00 - 5.18 {All 18 H, m, 3.70 (s) }, 6.80 - 7.64 (7 H, m).

{1463}

Working Example 650

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.89 (2 H, t, J=6Hz), 4.35 (2 H, t, J=6Hz), 7.0 (1 H, d, J=7Hz), 7.2 - 7.7 (10 H, m), 7.99 (1 H, d, J=2.5Hz).

{1464}

Working Example 651

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.33 (3 H, t, J=7Hz), 3.44 (2 H, dt, J=6.4Hz , J=2.4Hz), 3.98 (2 H, t, J=6.4Hz), 4.23 (2 H, q, J=7Hz), 6.41 (1 H, t, J=2.4Hz), 6.86 (1 H, d, J=8.6Hz),7.0 (1 H, dd, J=8.4Hz , J=2.4Hz), 7.35 - 7.70 (10 H, m).

{1465}

Working Example 652

compound

¹H-NHR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.29 (3 H, t, J=7Hz), 1.8 - 2.3 (2 H, m), 2.6 - 2.8 (1 H, m), 2.8 - 3.0 (1 H, m), 3.3 -3.56 (1 H, m), 3.85 - 4.1 (2 H, m), 4.22 (2 H, q, J=7Hz), 6.69 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.89 (1 H, dd, J=8.6Hz , J=2.4Hz), 7.2 - 7.7 (10 H, m).

{1466}

Working Example 653

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-1.7(5H,m), 1.7-2.1(5H,m), 2.4-2.75(1H,m), 2.85(2H,t,J=6 Hz), 4.3(2H,t,J=6Hz), 7.0(1H,d,J=8.8Hz), 7.19-7.27(3H,m), 7.40-7.45(2H,m), 7.96(1H,d,J=2.5 Hz)。

【1467】

実施例 654

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.9(2H,t,J=6.4 Hz), 3.96(3H,s), 4.31(2H,t,J=6.4Hz), 6.94-7.1(2 H,m), 7.35-7.40(2H,m), 7.77(1H,d,J=8.3Hz), 8.0(1H,d,J=2.5Hz)。

【1468】

実施例 655

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.85-2.05(1H, m), 2.15-2.35(1H,m), 2.65(1H,m), 2.85(1H,m), 3.35-3.55(1H,m), 3.85-4.10(2H,m), 6.70(1H,d, J=8.6Hz), 6.90(1H,dd,J=8.6Hz,J=2.4Hz), 7.25-7.65(10H,m)。

【1469】

実施例 656

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-1.55(5H, m), 1.33(3H,t,J=7.2Hz), 1.65-2.0(5H,m), 2.45-2.65(1H,m), 3.35-3.5(2H,m), 3.94(2H,t,J=6.4Hz), 4.22(2H,q,J=7.2Hz), 6.40(1H,t,J=2.3Hz), 6.85(1H,d,J=8.7Hz), 7.05(1H,dd,J=8.7Hz,J=2.3Hz), 7.15(2H,d,J=8.2Hz), 7.34(2H,d,J=8.2Hz), 7.65(1H,d,J=2.3Hz)。

【1470】

実施例 657

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-1.60(5H, m), 1.70-2.0(6H,m), 2.10-2.35(1H,m), 2.35-2.65(1H,m), 2.67(1H,dd,J=16Hz,J=6Hz), 2.90(1H, dd,J=16Hz,J=6Hz), 3.35-3.55(1H,m), 3.85-4.05(2H,m), 6.70(1H,d,J=8.7Hz), 6.89(1H,dd,J=8.7 Hz,J=2.3Hz), 7.12(2H,d,J=8.2Hz), 7.19(1H,d,J=2.3Hz), 7.28(2H,d,J=8.2Hz)。

【1471】

実施例 658

の化合物

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.1- 1.7 (5 H, m), 1.7 - 2.1 (5 H, m), 2.4 - 2.75 (1 H, m), 2.85 (2 H, t, J=6Hz), 4.3 (2 H, t, J=6Hz), 7.0 (1 H, d, J=8.8Hz), 7.19 - 7.27 (3 H, m), 7.40 - 7.45 (2 H, m), 7.96 (1 H, d, J=2.5Hz).

{1467}

Working Example 654

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.9 (2 H, t, J=6.4Hz), 3.96 (3 H, s), 4.31 (2 H, t, J=6.4Hz), 6.94 - 7.1 (2 H, m), 7.35 - 7.40(2 H, m), 7.77 (1 H, d, J=8.3Hz), 8.0 (1 H, d, J=2.5Hz).

{1468}

Working Example 655

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.85-2.05 (1 H, m), 2.15 - 2.35 (1 H, m), 2.65 (1 H, m), 2.85 (1 H, m), 3.35 - 3.55(1 H, m), 3.85 - 4.10 (2 H, m), 6.70 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.90 (1 H, dd, J=8.6Hz , J=2.4Hz), 7.25 - 7.65 (10 H, m).

{1469}

Working Example 656

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.1- 1.55 (5 H, m), 1.33 (3 H, t, J=7.2Hz), 1.65 - 2.0 (5 H, m), 2.45 - 2.65 (1 H, m), 3.35 -3.5 (2 H, m), 3.94 (2 H, t, J=6.4Hz), 4.22 (2 H, q, J=7.2Hz), 6.40 (1 H, t, J=2.3Hz), 6.85 (1 H, d, J=8.7Hz), 7.05 (1 H, dd, J=8.7Hz , J=2.3Hz), 7.15 (2 H, d, J=8.2Hz), 7.34 (2 H, d, J=8.2Hz), 7.65 (1 H, d, J=2.3Hz).

{1470}

Working Example 657

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-1.60 (5 H, m), 1.70 - 2.0 (6 H, m), 2.10 - 2.35 (1 H, m), 2.35 - 2.65 (1 H, m), 2.67 (1 H, dd, J=16Hz , J=6Hz), 2.90 (1 H, dd, J=16Hz , J=6Hz), 3.35 - 3.55 (1 H, m), 3.85 - 4.05 (2 H, m), 6.70 (1 H, d, J=8.7Hz), 6.89 (1 H, dd, J=8.7Hz , J=2.3Hz), 7.12 (2 H, d, J=8.2Hz), 7.19 (1 H, d, J=2.3Hz), 7.28 (2 H, d, J=8.2Hz).

{1471}

Working Example 658

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.85-2.10(1H, m), 2.15-2.35(1H,m), 2.68(1H,dd,J=16Hz,J=8Hz), 2.87(1H,dd,J=16Hz,J=6.2Hz), 3.3-3.5(1H, m), 3.75(3H,s), 3.8-4.15(2H,m), 6.4-6.55(1H, m), 6.88(1H,dd,J=8.6Hz,J=2.3Hz), 7.20(1H,d,J=2.3Hz), 7.54(2H,d,J=8.9Hz), 8.16(2H,d,J=8.9Hz).

【1472】

実施例 659

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.85-2.10(1H, m), 2.20-2.40(1H,m), 2.71(1H,dd,J=16Hz,J=8.4Hz), 2.94(1H,dd,J=16Hz,J=6Hz), 3.35-3.55(1H, m), 3.85-4.10(2H,m), 6.70(1H,d,J=8.6Hz), 6.90(1H,dd,J=8.6Hz,J=2.3Hz), 7.21(1H,d,J=2.3Hz), 7.35-7.70(9H,m)。

【1473】

実施例 660

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.80-2.0(1H, m), 2.10-2.30(1H,m), 2.62(1H,dd,J=15.6Hz,J=8.6Hz), 2.84(1H,dd,J=15.6Hz,J=6Hz), 3.3-3.5(1H,m), 3.73(3H,s), 3.80-4.10(4H,m), 6.50(2H,d,J=8.5Hz), 6.67(1H,d,J=8.5Hz), 6.89(1H,dd,J=8.7Hz,J=2.2Hz), 7.15-7.35(3H,m)。

【1474】

実施例 661

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.75-1.95(1H, m), 2.10-2.30(1H,m), 2.63(1H,dd,J=15.6Hz,J=8.4Hz), 2.85(1H,dd,J=15.6Hz,J=6.2Hz), 3.3-3.5(1H,m), 3.74(3H,s), 3.80-4.05(2H,m), 4.61(2H,s), 6.6(1H,d,J=8.6Hz), 6.88(1H,dd,J=8.6Hz,J=2.2Hz), 6.95-7.65,8.36[全 11H,m,8.36(s)]。

【1475】

実施例 662

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.80-2.10(1H, m), 2.15-2.30(1H,m), 2.71(1H,dd,J=16Hz,J=8Hz), 2.90(1H,dd,J=16Hz,J=6Hz), 3.3-3.5(1H,m), 3.75-4.10(2H,m), 4.60(2H,s), 6.59(1H,d,J=8.6Hz), 6.88(1H,dd,J=8.6Hz,J=2.2Hz), 6.97(2H,d,J=7.8Hz), 6.99-7.10(1H,m), 7.20(1H,d,J=2.2Hz), 7.31-7.39(4H,m), 7.54(2H,d,J=8.6Hz), 8.38(1H, s)。

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.85-2.10 (1 H, m), 2.15 - 2.35 (1 H, m), 2.68 (1 H, dd, J=16Hz , J=8Hz), 2.87 (1 H, dd, J=16Hz , J=6.2Hz), 3.3 - 3.5 (1 H, m),3.75 (3 H, s), 3.8 - 4.15 (2 H, m), 6.4 - 6.55 (1 H, m), 6.88 (1 H, dd, J=8.6Hz , J=2.3Hz), 7.20 (1 H, d, J=2.3Hz), 7.54 (2 H, d, J=8.9Hz), 8.16(2 H, d, J=8.9Hz)。

{1472}

Working Example 659

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.85-2.10 (1 H, m), 2.20 - 2.40 (1 H, m), 2.71 (1 H, dd, J=16Hz , J=8.4Hz), 2.94 (1 H, dd, J=16Hz , J=6Hz), 3.35 - 3.55 (1 H, m), 3.85 - 4.10 (2 H, m), 6.70 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.90 (1 H, dd, J=8.6Hz , J=2.3Hz), 7.21 (1 H, d, J=2.3Hz), 7.35 - 7.70 (9 H, m)。

{1473}

Working Example 660

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.80-2.0 (1 H, m), 2.10 - 2.30 (1 H, m), 2.62 (1 H, dd, J=15.6Hz , J=8.6Hz), 2.84 (1 H, dd, J=15.6Hz , J=6Hz), 3.3 - 3.5 (1 H, m),3.73 (3 H, s), 3.80 - 4.10 (4 H, m), 6.50 (2 H, d, J=8.5Hz), 6.67 (1 H, d, J=8.5Hz), 6.89 (1 H, dd, J=8.7Hz , J=2.2Hz), 7.15 - 7.35 (3 H, m)。

{1474}

Working Example 661

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.75-1.95 (1 H, m), 2.10 - 2.30 (1 H, m), 2.63 (1 H, dd, J=15.6Hz , J=8.4Hz), 2.85 (1 H, dd, J=15.6Hz , J=6.2Hz), 3.3 - 3.5 (1 H, m),3.74 (3 H, s), 3.80 - 4.05 (2 H, m), 4.61 (2 H, s), 6.6 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.88 (1 H, dd, J=8.6Hz , J=2.2Hz), 6.95 - 7.65 and 8.36 {All 11 H, m, 8.36 (s) }。

{1475}

Working Example 662

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.80-2.10 (1 H, m), 2.15 - 2.30 (1 H, m), 2.71 (1 H, dd, J=16Hz , J=8Hz), 2.90 (1 H, dd, J=16Hz , J=6Hz), 3.3 - 3.5 (1 H, m),3.75 - 4.10 (2 H, m), 4.60 (2 H, s), 6.59 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.88 (1 H, dd, J=8.6Hz , J=2.2Hz), 6.97 (2 H, d, J=7.8Hz), 6.99 - 7.10 (1 H, m),7.20 (1 H, d, J=2.2Hz), 7.31 - 7.39 (4 H, m), 7.54 (2 H, d, J=8.6Hz), 8.38 (1 H, s)。

s)。

【1476】

実施例 663

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.75-1.95(1H, m), 2.10-2.20(1H,m), 2.2(3H,s), 2.60(1H,dd,J=15.7Hz,J=8.6Hz), 2.83(1H,dd,J=15.7Hz,J=6Hz), 3.3-3.4(1H,m), 3.78(3H,s), 3.8-4.0(2H,m), 4.69(2H,s), 6.60(1H,d,J=8.7Hz), 6.87(2H,dt,J=8.6Hz,J=2.2Hz), 6.94-7.01(1H,m), 7.10-7.50(5H, m), 7.64(2H,d,J=8.7Hz), 7.74(1H,s), 9.60(1H, s)。

【1477】

実施例 664

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.75-2.00(1H, m), 2.15-2.35(1H,m), 2.64(1H,dd,J=15.7Hz,J=8.6Hz), 2.86(1H,dd,J=15.7Hz,J=6Hz), 3.3-3.5(1 H,m), 3.75(3H,s), 3.80-4.00(2H,m), 4.72(2H,s), 6.61(1H,d,J=8.6Hz), 6.87(1H,dd,J=8.8Hz,J=2.2 Hz), 6.93-7.07(2H,m), 7.17(1H,d,J=2.2Hz), 7.25-7.50(4H,m), 7.58(2H,d,J=8.6Hz), 8.78(1H,s)。

【1478】

実施例 665

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.80-2.05(1H, m), 2.10-2.30(1H,m), 2.71(1H,dd,J=16Hz,J=8,2 Hz), 2.92(1H,dd,J=16Hz,J=6Hz), 3.30-3.50(1H, m), 3.75-4.10(2H,m), 4.65(2H,s), 6.55-7.65[全 11H,m,6.60(d,J=8.6Hz), 7.57(d,J=8.6Hz)],8.79 (1H,s)。

【1479】

実施例 666

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.80-2.0(1H, m), 2.1-2.3(1H,m), 2.36(3H,s), 2.63(1H,dd,J=15.6Hz,J=8.5Hz), 2.86(1H,dd,J=15.6Hz,J=6Hz), 3.3-3.5(1H,m), 3.74(3H,s), 3.83-3.99(2H,m), 4.59(2H,s), 6.60(1H,d,J=8.6Hz), 6.78(2H,d,J=8Hz), 6.88(2H,dd,J=8.6Hz,J=2Hz), 7.16-7.26(2H, m), 7.38(2H,d,J=8.7Hz), 7.55(2H,d,J=8.7Hz), 8.36(1H,s)。

【1480】

{1476}

Working Example 663

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm:1.75-1.95 (1 H, m), 2.10 - 2.20 (1 H, m), 2.2 (3 H, s), 2.60 (1 H, dd, J=15.7Hz, J=8.6Hz), 2.83 (1 H, dd, J=15.7Hz, J=6Hz), 3.3 -3.4 (1 H, m), 3.78 (3 H, s), 3.8 - 4.0 (2 H, m), 4.69 (2 H, s), 6.60 (1 H, d, J=8.7Hz), 6.87 (2 H, dt, J=8.6Hz, J=2.2Hz), 6.94 - 7.01(1 H, m), 7.10 - 7.50 (5 H, m), 7.64 (2 H, d, J=8.7Hz), 7.74 (1 H, s), 9.60 (1 H, s).

{1477}

Working Example 664

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm:1.75-2.00 (1 H, m), 2.15 - 2.35 (1 H, m), 2.64 (1 H, dd, J=15.7Hz, J=8.6Hz), 2.86 (1 H, dd, J=15.7Hz, J=6Hz), 3.3 - 3.5 (1 H, m), 3.75 (3 H, s), 3.80 - 4.00 (2 H, m), 4.72 (2 H, s), 6.61 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.87 (1 H, dd, J=8.8Hz, J=2.2Hz), 6.93 - 7.07 (2 H, m), 7.17 (1 H, d, J=2.2Hz), 7.25 - 7.50 (4 H, m), 7.58 (2 H, d, J=8.6Hz), 8.78 (1 H, s).

{1478}

Working Example 665

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm:1.80-2.05 (1 H, m), 2.10 - 2.30 (1 H, m), 2.71 (1 H, dd, J=16Hz, J=8,2Hz), 2.92 (1 H, dd, J=16Hz, J=6Hz), 3.30 - 3.50 (1 H, m), 3.75 - 4.10 (2 H, m), 4.65 (2 H, s), 6.55 - 7.65 {All 11 H, m, 6.60 (d, J=8.6Hz), 7.57 (d, J=8.6Hz)}, 8.79 (1 H, s).

{1479}

Working Example 666

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm:1.80-2.0 (1 H, m), 2.1 - 2.3 (1 H, m), 2.36 (3 H, s), 2.63 (1 H, dd, J=15.6Hz, J=8.5Hz), 2.86 (1 H, dd, J=15.6Hz, J=6Hz), 3.3 -3.5 (1 H, m), 3.74 (3 H, s), 3.83 - 3.99 (2 H, m), 4.59 (2 H, s), 6.60 (1 H, d, J=8.6Hz), 6.78 (2 H, d, J=8Hz), 6.88 (2 H, dd, J=8.6Hz, J=2Hz), 7.16 - 7.26 (2 H, m), 7.38 (2 H, d, J=8.7Hz), 7.55 (2 H, d, J=8.7Hz), 8.36 (1 H, s).

{1480}

実施例 667

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.8-2.25,2.65-4.10(全 10H,m), 4.68(2H,s), 6.4-7.85(全 13H,m), 9.48(1H,s)。

【1481】

実施例 668

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.8-3.0(全 7H,m), 3.25-3.50(1H,m), 3.70-4.05(2H,m), 4.56(2H,s), 6.60(1H,d,J=8.5Hz), 6.75-6.90(4H,m), 7.18-7.26(2H,m), 7.35(2H,d,J=8.6Hz), 7.52(2H,d,J=8.7Hz), 8.4(1H,s)。

【1482】

実施例 669

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.9-2.25,2.6-4.1,4.3-4.75[全 15H,m,0.99(t,J=7.2Hz)],6.8-7.5,7.55-7.65,8.2-8.5[全 13H,m,7.60(d,J=4Hz), 8.25(d,J=4Hz)]。

【1483】

実施例 670

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.3-2.2,2.35-2.5,2.7-3.9 及び 4.4-4.65[全 15H,m,2.40(s), 3.73(s)],6.55(0.6H,d,J=8.3Hz), 6.89(1.3H,d,J=8.3Hz), 7.0-7.5(全 4H,m), 8.35-8.50(0.8H,m), 8.9-9.05(0.25H,m)。

【1484】

実施例 671

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-2.2,2.7-3.4, 3.5-3.8 及び 4.45-4.65[全 12H,m,3.69(s)],6.85-7.5 及び 8.9-9.1(全 8H,m)。

【1485】

実施例 672

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.4-2.3,2.75-3.25 及び 4.75-5.05(全 8H,m), 6.75-7.45(全 7H,m), 9.55 及び 10.03(全 1H,各 s)。

【1486】

Working Example 667

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.8-2.25, 2.65-4.10 (All 10 H, m), 4.68 (2 H, s), 6.4 - 7.85 (All 13 H, m), 9.48 (1 H, s) .

{1481}

Working Example 668

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.8-3.0 (All 7 H, m), 3.25 - 3.50 (1 H, m), 3.70 - 4.05 (2 H, m), 4.56 (2 H, s), 6.60(1 H, d, J=8.5Hz), 6.75 - 6.90 (4 H, m), 7.18 - 7.26 (2 H, m), 7.35 (2 H, d, J=8.6Hz), 7.52 (2 H, d, J=8.7Hz), 8.4 (1 H, s) .

{1482}

Working Example 669

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.9-2.25, 2.6-4.1, 4.3- 4.75 {All 15 H, m, 0.99 (t, J=7.2Hz) }, 6.8 - 7. 5 and 7. 55 - 7.658.2 - 8.5 {All 13 H, m, 7.60 (d, J=4Hz), 8.25 (d, J=4Hz) } .

{1483}

Working Example 670

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.3- 2.2, 2.35-2.5, 2.7-3.9 and 4.4 - 4.65 {All 15 H, m, 2.40 (s) , 3.73 (s) }, 6.55 (0.6 H, d, J=8.3Hz), 6.89 (1.3 H, d, J=8.3Hz), 7.0 - 7.5 (All 4 H, m),8.35 - 8.50 (0.8 H, m), 8.9 - 9.05 (0.25 H, m) .

{1484}

Working Example 671

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.1- 2.2, 2.7-3.4, 3.5-3.8 and 4.45 - 4.65 {All 12 H, m, 3.69 (s) }, 6.85 - 7.5 and 8.9 - 9.1 (All 8 H, m) .

{1485}

Working Example 672

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.4- 2.3, 2.75-3.25 and 4.75 - 5.05 (All 8 H, m), 6.75 - 7.45 (All 7 H, m), 9.55 and 10.03(All 1 H, each s) .

{1486}

実施例 673

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.2,2.6-3.85 及び 4.4-4.65[全 15H,m,2.83(s)],6.21(0.7H,d,d,J=8.7Hz,J=2.5Hz), 6.51(0.6H,d,J=2.5Hz), 6.6-7.4(全 5.7H,m)。

【1487】

実施例 674

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.0-2.1,2.7-3.9, 4.4-5.3[全 17H,m,1.1(d,J=6Hz)],6.0-6.1 及び 6.4-7.6(全 8H,m)。

【1488】

実施例 675

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.2,2.7-4.0 及び 4.45-4.7(全 13H,m), 5.9 及び 6.9-7.7[全 8 H,m,5.9(s)]。

【1489】

実施例 676

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.35,2.75-3.10,3.10-3.95 及び 4.4-4.6[全 16H,m,2.79(s)],6.3-7.6(全 7H,m)。

【1490】

実施例 677

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-1.25,1.25-2.2,2.7-3.95 及び 4.45-4.65(全 22H,m), 6.85-7.8 (全 7H,m), 7.8-8.5(1H,m)。

【1491】

実施例 678

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.05,2.65-4.0 及び 4.3-4.65[全 15H,m,4.39(s)],5.8-6.85(1 H,m), 6.85-8.15(全 12H,m)。

【1492】

実施例 679

の化合物

Working Example 673

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.2, 2.6-3.85 and 4.4 - 4.65 {All 15 H, m, 2.83 (s) }, 6.21 (0.7 H, dd, J=8.7Hz , J=2.5Hz), 6.51 (0.6 H, d, J=2.5Hz), 6.6 - 7.4 (All 5.7 H, m).

{1487}

Working Example 674

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.0-2.1, 2.7-3.9, 4.4- 5.3 {All 17 H, m, 1.1 (d, J=6Hz) }, 6.0 - 6.1 and 6.4 - 7.6 (All 8 H, m).

{1488}

Working Example 675

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.2- 2.2, 2.7-4.0 and 4.45 - 4.7 (All 13 H, m), 5.9 and 6.9 - 7.7 {All 8 H, m, 5.9 (s) }.

{1489}

Working Example 676

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.2- 2.35, 2.75-3.10, 3.10-3.95 and 4.4 - 4.6 {All 16 H, m, 2.79 (s) }, 6.3 - 7.6 (All 7 H, m).

{1490}

Working Example 677

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.1- 1.25, 1.25-2.2, 2.7-3.95 and 4.45 - 4.65 (All 22 H, m), 6.85 - 7.8 (All 7 H, m), 7.8 - 8.5 (1 H, m).

{1491}

Working Example 678

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.35-2.05, 2.65-4.0 and 4.3 - 4.65 {All 15 H, m, 4.39 (s) }, 5.8 - 6.85 (1 H, m), 6.85 - 8.15 (All 12 H, m).

{1492}

Working Example 679

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.04-2.20[全 7 H,m,1.41(t,J=7.0Hz)],2.32-3.32,3.33-4.30,4.43-4.70 及び 5.00-5.22(全 13H,m,2.51(s), 3.72(s)), 6.43-7.67(11H,m)。

【1493】

実施例 680

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03(3H,t,J=7.0 Hz), 0.90-2.30(6H,m), 2.38-3.30,3.38-4.36,4.43-4.70 及び 5.04-5.23[全 13H,m,2.52(s), 3.72(s), 3.93(t)],6.43-7.64(11H,m)。

【1494】

実施例 683

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.24-3.02(5H, m), 3.04-3.89,3.90-4.88 及び 4.93-5.14(全 10H, m,3.71(s), 3.74(s), 3.76(s), 3.82(s)),6.49-6.65, 6.71-6.86,6.94-7.10,7.11-7.42 及び 7.58-7.78(全 6 H,m)。

【1495】

実施例 684

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.23,2.24-3.93,4.01-4.31,4.43-4.70 及び 5.01-5.22[全 18H, m,2.37(s), 2.44(s), 2.53(s), 2.57(s), 3.72(s)],6.47-7.59(11H,m)。

【1496】

実施例 685

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-2.26(4H, m), 2.56-4.32,4.45-4.73 及び 5.00-5.20[全 8H,m, 3.71(s)],6.68-7.81(12H,m)。

【1497】

実施例 686

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.37,2.42-4.39,4.47-4.75 及び 5.04-5.26[全 15H,m,2.56(s), 3.73(s)],6.49-7.95 及び 8.13-8.49(全 11H,m)。

【1498】

実施例 687

All 13 H, m, 2.51 (s), 3.72 (s)), 6.43 - 7.67 (11 H, m).

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.04-2.20 {All 7 H, m, 1.41 (t, J=7.0Hz) }, 2.32 - 3.32 and 3.33 - 4.30 and 4.43 - 4.70 and 5.00 - 5.22

{1493}

Working Example 680

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.03 (3 H, t, J=7.0Hz), 0.90 - 2.30 (6 H, m), 2.38 - 3.30 and 3.38 - 4.36 and 4.43 - 4.70 and 5.04 - 5.23 {All 13 H, m, 2.52 (s), 3.72 (s), 3.93 (t) }, 6.43 - 7.64 (11 H, m).

{1494}

Working Example 683

compound

All 10 H, m, 3.71 (s), 3.74 (s), 3.76 (s), 3.82 (s)), 6.49 - 6.65 and 6.71 - 6.86 and 6.94 - 7.10 and 7.11 - 7.42 and 7.58 - 7.78(All 6 H, m). ¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.24-3.02 (5 H, m), 3.04 - 3.89 and 3.90 - 4.88 and 4.93 - 5.14

{1495}

Working Example 684

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.12-2.23, 2.24-3.93, 4.01-4.31, 4.43-4.70 and 5.01 - 5.22 {All 18 H, m, 2.37 (s), 2.44 (s), 2.53 (s), 2.57 (s), 3.72 (s) }, 6.47 - 7.59 (11 H, m).

{1496}

Working Example 685

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.11-2.26 (4 H, m), 2.56 - 4.32 and 4.45 - 4.73 and 5.00 - 5.20{All 8 H, m, 3.71 (s) }, 6.68 - 7.81 (12 H, m).

{1497}

Working Example 686

compound

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.13-2.37, 2.42-4.39, 4.47-4.75 and 5.04 - 5.26 {All 15 H, m, 2.56 (s), 3.73 (s) }, 6.49 - 7.95 and 8.13 - 8.49 (All 11 H, m).

{1498}

Working Example 687

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) ppm:1.18-2.27(4H, m), 2.28-4.39,4.45-4.72 及び 5.03-5.27[全 14H, m,2.35(s), 2.41(s), 2.52(s), 2.56(s)],6.49-7.64(1H,m)。

【1499】

実施例 689

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm1.00-3.76,4.28-4.55 及び 4.81-5.05[全 15H,m,2.31(s), 2.44(s)],6.49-7.79(11H,m), 12.31(1H,s)。

【1500】

実施例 690

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.04-2.22(4H,m), 2.32-3.76,4.27-4.58 及び 4.81-5.08(全 8H, m), 6.49-8.48(11H,m), 11.97-12.54(1H,m)。

【1501】

実施例 691

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) ppm:1.02-3.86,4.36-4.62 及び 5.01-5.30[全 26H,m,2.41(s), 3.74(s)], 6.36-7.40(6H,m)。

【1502】

実施例 692

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.20-3.01,3.32-4.28 及び 4.78-5.49[全 23H,m,2.35(s), 2.44(s), 3.82(s)],6.55-7.75(11H,m)。

【1503】

実施例 693

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.05(10H, m), 2.19-2.95,3.42-4.25 及び 4.75-5.39[全 21H, m,2.35(s)],6.59-7.55(7H,m)。

【1504】

実施例 696

の化合物

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃) ppm :1.18-2.27 (4 H, m), 2.28 - 4. 39 and 4. 45 - 4.72 and 5.03 - 5.27 {All 14 H, m, 2.35 (s), 2.41 (s), 2.52 (s), 2.56 (s) }, 6.49 - 7.64 (11 H, m).

{1499}

Working Example 689

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆) ;de ppm 1.00-3.76, 4.28-4.55 and 4.81 - 5.05 {All 15 H, m, 2.31 (s), 2.44 (s) }, 6.49 - 7.79 (11 H, m), 12.31 (1 H, s).

{1500}

Working Example 690

compound

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆) ;de ppm :1.04-2.22 (4 H, m), 2.32 - 3. 76 and 4. 27 - 4.58 and 4.81 - 5.08(All 8 H, m), 6.49 - 8.48 (11 H, m), 11.97 - 12.54 (1 H, m).

{1501}

Working Example 691

compound

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃) ppm :1.02-3.86, 4.36-4.62 and 5.01 - 5.30 {All 26 H, m, 2.41 (s), 3.74 (s) }, 6.36 - 7.40 (6 H, m).

{1502}

Working Example 692

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;de ppm :2.20-3.01, 3.32-4.28 and 4.78 - 5.49 {All 23 H, m, 2.35 (s), 2.44 (s), 3.82 (s) }, 6.55 - 7.75 (11 H, m).

{1503}

Working Example 693

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;de ppm :1.12-2.05 (10 H, m), 2.19 - 2. 95 and 3. 42 - 4.25 and 4.75 - 5.39 {All 21 H, m, 2.35 (s) }, 6.59 - 7.55 (7 H, m).

{1504}

Working Example 696

compound

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.48(3H,d,J=6.6Hz), 1.57-2.13(2H,m), 2.86-3.13(2H,m), 3.36-3.65(1H,m), 4.43-4.63(1H,m), 4.70-4.93(1H,m), 6.48-8.00(12H,m), 10.19 及び 10.46(全 1H, s), 12.68(1H,brs)。

【1505】

実施例 700

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.31(3H,t,J=7.1Hz), 1.58(3H,d,J=6.7Hz), 1.51-2.33(2H,m), 2.97-3.23(2H,m), 3.40-3.70(1H,m), 3.81-4.18(2H,m), 4.25(2H,q,J=7.1Hz), 4.40-4.91(1H,m), 4.73(1H,q,J=6.7Hz), 6.51-7.65(12H,m), 8.22(1H,brs)。

【1506】

実施例 701

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.34(3H,t,J=7.1Hz), 2.28-3.00(2H,m), 3.71-5.12(全 6H,m), 6.85-7.65 及び 7.75-8.45(全 7H,m)。

【1507】

実施例 702

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.32(3H,t,J=7.12Hz), 2.32-2.90(2H,m), 3.61-4.49(全 6H,m), 4.65-5.05(2H,m), 6.10-7.68(全 7H,m)。

【1508】

実施例 703

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.22-1.43(3H,m), 1.78-2.38(2H,m), 2.99-3.24(2H,m), 3.43-3.66(1H,m), 3.78-4.39(4H,m), 4.65-4.89(1H,m), 6.67(1H,dt,J=7.6,J=1.3Hz), 6.70(1H,dd,J=8.2,J=1.3Hz), 6.89-6.99(1H,m), 7.05(1H,dd,J=7.3,J=1.7Hz), 7.37(1H,d,J=8.4Hz), 7.81(1H,dd,J=8.4,J=2.1Hz), 8.10(1H,d,J=2.1Hz)。

【1509】

実施例 704

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.32(3H,t,J=7.16Hz), 1.50-1.81[全 3H,m,1.59(d,J=6.71Hz)],2.50-2.95 及び 3.69-5.15(全 9H,m), 6.81-8.55[13

¹H-nmr (200 MHz , DMSO

-d₆);de ppm :1.48 (3 H, d, J=6.6Hz), 1.57 - 2.13 (2 H, m), 2.86 - 3.13 (2 H, m), 3.36 - 3.65 (1 H, m),4.43 - 4.63 (1 H, m), 4.70 - 4.93 (1 H, m), 6.48 - 8.00 (12 H, m), 10.19 and 10.46 (All 1 H, s),12.68 (1 H, brs).

{1505}

Working Example 700

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de

ppm :1.31 (3 H, t, J=7.1Hz), 1.58 (3 H, d, J=6.7Hz), 1.51 - 2.33 (2 H, m), 2.97 - 3.23 (2 H, m), 3.40 - 3.70 (1 H, m), 3.81 - 4.18 (2 H, m), 4.25 (2 H, q, J=7.1Hz), 4.40 - 4.91 (1 H, m), 4.73 (1 H, q, J=6.7Hz), 6.51 - 7.65(12 H, m), 8.22 (1 H, brs).

{1506}

Working Example 701

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de

ppm :1.34 (3 H, t, J=7.1Hz), 2.28 - 3.00 (2 H, m), 3.71 - 5.12 (All 6 H, m), 6.85 - 7.65 and7.75 - 8.45 (All 7 H, m).

{1507}

Working Example 702

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de

ppm :1.32 (3 H, t, J=7.12Hz), 2.32 - 2.90 (2 H, m), 3.61 - 4.49 (All 6 H, m), 4.65 - 5.05 (2 H, m),6.10 - 7.68 (All 7 H, m).

{1508}

Working Example 703

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de

ppm :1.22-1.43 (3 H, m), 1.78 - 2.38 (2 H, m), 2.99 - 3.24 (2 H, m), 3.43 - 3.66 (1 H, m),3.78 - 4.39 (4 H, m), 4.65 - 4.89 (1 H, m), 6.67 (1 H, dt, J=7.6, J=1.3Hz), 6.70 (1 H, dd, J=8.2, J=1.3Hz), 6.89 - 6.99 (1 H, m), 7.05(1 H, dd, J=7.3, J=1.7Hz), 7.37 (1 H, d, J=8.4Hz), 7.81 (1 H, dd, J=8.4, J=2.1Hz), 8.10 (1 H, d, J=2.1Hz).

{1509}

Working Example 704

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de

ppm :1.32 (3 H, t, J=7.16Hz), 1.50 - 1.81 {All 3 H, m, 1.59 (d, J=6.71Hz) }, 2.50 - 2.95 and 3.69 - 5.15 (All 9 H,

H,m,7.55(s), 8.26(s)]。

【1510】

実施例 705

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.41-1.75[全 3 H,m,1.59(d,J=6.76Hz)],1.75-2.89,3.60-4.48 及び 4.60-5.10(全 7H,m), 6.79-8.20 及び 8.36-8.88(全 12H,m)。

【1511】

実施例 706

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.72-1.10(6H, m), 1.33(3H,t,J=7.13Hz), 1.80-2.10,2.55-2.90,3.69-4.59 及び 4.75-5.05[全 11H,m,7.29(q,J=7.13 Hz)],6.71-7.85,8.59-8.70[全 8H,m,6.63(s)]。

【1512】

実施例 707

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.33(3H,t,J=6.17Hz), 2.31-2.95 及び 3.39-5.10(全 12H,m), 6.7-7.89(8H,m)。

【1513】

実施例 708

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.34(3H,t,J=7.15Hz), 2.55-3.05,3.70-4.61 及び 4.79-5.08[全 12 H,m,4.29(q,J=7.15Hz), 4.46(t,J=7.88Hz)],6.81-7.72(7H,m)。

【1514】

実施例 709

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.89(6H,d,J=6.69Hz), 1.70-2.05,2.30-4.20 及び 4.45-4.82(全 9H,m), 6.85-7.79,8.10-8.20 及び 9.65-9.95[全 8 H,m,8.14(s), 9.70(s)]。

【1515】

実施例 710

の化合物

m),6.81 - 8.55 {13 H, m, 7.55 (s), 8.26 (s)}.

{1510}

Working Example 705

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.41-1.75 {All 3 H, m, 1.59 (d, J=6.76Hz)}, 1.75 - 2.89 and 3.60 - 4.48 and 4.60 - 5.10(All 7 H, m), 6.79 - 8.20 and 8.36 - 8.88 (All 12 H, m).

{1511}

Working Example 706

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :0.72-1.10 (6 H, m), 1.33 (3 H, t, J=7.13Hz), 1.80 - 2.10 and 2.55 - 2.90 and 3.69 - 4.59 and 4.75 - 5.05 {All 11 H, m, 7.29 (q, J=7.13Hz)}, 6.71 - 7.85 and 8.59 - 8.70 {All 8 H, m, 6.63 (s)}.

{1512}

Working Example 707

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.33 (3 H, t, J=6.17Hz), 2.31 - 2.95 and 3.39 - 5.10 (All 12 H, m), 6.72 - 7.89 (8 H, m).

{1513}

Working Example 708

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.34 (3 H, t, J=7.15Hz), 2.55 - 3.05 and 3.70 - 4.61 and 4.79 - 5.08 {All 12 H, m, 4.29 (q, J=7.15Hz), 4.46 (t, J=7.88Hz)}, 6.81 - 7.72 (7 H, m).

{1514}

Working Example 709

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO -d₆);de ppm :0.89 (6 H, d, J=6.69Hz), 1.70 - 2.05 and 2.30 - 4.20 and 4.45 - 4.82(All 9 H, m), 6.85 - 7.79 and 8.10 - 8.20 and 9.65 - 9.95 {All 8 H, m, 8.14 (s), 9.70 (s)}.

{1515}

Working Example 710

compound

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.05-5.05(1H,m), 6.70-8.00(7H,m)。

【1516】

実施例 711

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.99-1.98,2.18-3.00 及び 3.64-4.01[全 18H,m,2.34(s)],6.50-7.61 及び 8.40-8.73(全 8H,m)。

【1517】

実施例 712

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.43(3H,s), 2.62-3.00,3.71-4.20 及び 4.55-5.29[全 7H,m,3.82(s)],6.62-7.65 及び 8.45-8.75[全 12H,m,7.42(d,J=8.45Hz)]。

【1518】

実施例 713

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-3.81 及び 4.81-5.35[全 21H,m,2.37(s)],6.35-7.50(7H,m)。

【1519】

実施例 714

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.55-4.05 及び 4.85-5.25[全 13H,m,2.46(s), 3.81(s)],6.40-7.61(11H,m)。

【1520】

実施例 715

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.04-2.01,2.18-3.10,3.56-4.49 及び 4.61-5.65[全 20H,m,2.35(s)],6.51-7.65(7H,m)。

【1521】

実施例 716

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.34(3H,t,J=7.08Hz), 2.15-3.10,3.61-4.51 及び 4.78-5.11[全 14H,m,2.44(s), 3.83(s)],6.61-7.58(11H,m)。

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm 2.05-5.05 (1 H, m), 6.70 - 8.00 (7 H, m).

{1516}

Working Example 711

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.99-1.98, 2.18-3.00 and 3.64 - 4.01 {All 18 H, m, 2.34 (s) }, 6.50 - 7.61 and 8.40 - 8.73 (All 8 H, m).

{1517}

Working Example 712

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :2.43 (3 H, s), 2.62 - 3.00 and 3.71 - 4.20 and 4.55 - 5.29{All 7 H, m, 3.82 (s) }, 6.62 - 7.65 and 8.45 - 8.75 {All 12 H, m, 7.42 (d, J=8.45Hz) }.

{1518}

Working Example 713

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-3.81 and 4.81 - 5.35 {All 21 H, m, 2.37 (s) }, 6.35 - 7.50 (7 H, m).

{1519}

Working Example 714

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.55-4.05 and 4.85 - 5.25 {All 13 H, m, 2.46 (s) }, 3.81 (s) }, 6.40 - 7.61 (11 H, m).

{1520}

Working Example 715

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.04-2.01, 2.18-3.10, 3.56-4.49 and 4.61 - 5.65 {All 20 H, m, 2.35 (s) }, 6.51 - 7.65 (7 H, m).

{1521}

Working Example 716

compound

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.34 (3 H, t, J=7.08Hz), 2.15 - 3.10 and 3.61 - 4.51 and 4.78 - 5.11{All 14 H, m, 2.44 (s) }, 3.83 (s) }, 6.61 - 7.58 (11 H, m).

【1522】

実施例 717

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.01-2.97,3.51-4.28 及び 4.75-5.19[全 20H,m,2.34(s)],6.40-7.70(8H,m)。

【1523】

実施例 718

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.29-2.94,3.56-4.29 及び 4.75-5.08[全 12H,m,2.43(s), 3.82(s)], 6.59-7.65(7H,m), 8.55-9.07(1H,m)。

【1524】

実施例 719

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.53(9H,s), 2.51-2.96,3.72-4.31 及び 4.51-5.18(全 6H,m), 6.85-7.62 及び 7.78-8.41(全 7H,m)。

【1542】

実施例 728

と同様にして適当な出発原料を用いて、前記実施例 416,417,457,515,523,524,677 及び 678 の化合物を得る。

【1630】

実施例 731

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.25-4.30 及び 4.6-4.85[全 27H,m,2.49(s), 2.84(s), 2.94(s)],6.85-8.0(全 7H,m)。

【1631】

実施例 733

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.1-2.1,2.4-4.1 及び 4.1-4.7(全 24H,m), 6.7-7.8,7.8-8.0 及び 8.35-8.7(全 7H,m), 11.1-11.7(1H,m)。

【1632】

実施例 734

(11 H, m).

{1522}

Working Example 717

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm:1.01-2.97, 3.51-4.28 and 4.75 - 5.19 {All 20 H, m, 2.34 (s) }, 6.40 - 7.70 (8 H, m).

{1523}

Working Example 718

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm:2.29-2.94, 3.56-4.29 and 4.75 - 5.08 {All 12 H, m, 2.43 (s), 3.82 (s) }, 6.59 - 7.65 (7 H, m), 8.55 - 9.07 (1 H, m).

{1524}

Working Example 719

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm:1.53 (9 H, s), 2.51 - 2.96 and 3.72 - 4.31 and 4.51 - 5.18(All 6 H, m), 6.85 - 7.62 and 7.78 - 8.41 (All 7 H, m).

{1542}

Working Example 728

Aforementioned Working Example 416, 417, 457, 515, 523, 524, 677 and compound of 678 are obtained making use of suitable starting material with to similar.

{1630}

Working Example 731

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm:1.25-4.30 and 4.6 - 4.85 {All 27 H, m, 2.49 (s), 2.84 (s), 2.94 (s) }, 6.85 - 8.0 (All 7 H, m).

{1631}

Working Example 733

compound

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm:1.1- 2.1, 2.4- 4.1 and 4.1 - 4.7 (All 24 H, m), 6.7 - 7.8, 7.8 - 8.0 and 8.35 - 8.7(All 7 H, m), 11.1 - 11.7 (1 H, m).

{1632}

Working Example 734

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.81-2.20, 2.6-4.0 及び 4.2-4.6(全 33H,m), 6.8-8.0(全 7H, m), 10.8-11.3(1H,m)。

【1633】

実施例 735

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.1-2.2,2.6-4.1 及び 4.3-4.6(全 26H,m), 6.8-7.9[全 12H,m,7.63(s), 7.93(s)],10.8-11.4(1H,m)。

【1634】

実施例 736

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.99-2.20,2.63-3.91 及び 4.81-5.08[全 23H,m,1.12(d,J=6.8Hz)], 6.48(1H,dd,J=8.6Hz,8.5Hz), 6.71-7.48(6H,m)。

【1635】

実施例 740

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-1.80,1.80-2.25,2.35-2.60,2.60-3.15,3.25-3.55,4.35-4.65 及び 4.85-5.05[全 15H,m,2.46,4.43 及び 4.48(各 s)],6.52-6.65,6.78-6.95 及び 7.12-7.55(全 11H, m)。

【1636】

実施例 741

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-1.88[9H, m(1.22 及び 1.35,各 3H,各 d,J=6.0Hz)],1.88-2.61[11H,m(2.33 及び 2.43,各 s)],2.61-4.04,4.31-4.70 及び 4.98-5.19(全 10H,m), 6.12-7.43(7H,m)。

【1637】

実施例 742

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-2.59[15 H,m(2.33 及び 2.45,各 s)],2.59-3.09(2H,m), 3.09-4.01 及び 4.43-4.64(全 6H,m), 4.93 及び 5.09 (全 2H,各 s), 6.24-7.51(12H,m)。

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), DMSO -d₆);de ppm :0.81-2.20, 2.6-4.0 and 4.2 - 4.6 (All 33 H, m), 6.8 - 8.0 (All 7 H, m), 10.8 - 11.3 (1 H, m).

{1633}

Working Example 735

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), DMSO -d₆);de ppm :1.1- 2.2, 2.6-4.1 and 4.3 - 4.6 (All 26 H, m), 6.8 - 7.9 {All 12 H, m, 7.63 (s), 7.93 (s) }, 10.8 - 11.4 (1 H, m).

{1634}

Working Example 736

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :0.99-2.20, 2.63-3.91 and 4.81 - 5.08 {All 23 H, m, 1.12 (d, J=6.8H_Z) }, 6.48 (1 H, dd, J=8.6H_Z, 8.5H_Z), 6.71 - 7.48 (6 H, m).

{1635}

Working Example 740

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :1.35-1.80, 1.80-2.25, 2.35-2.60, 2.60-3.15, 3.25-3.55, 4.35-4.65 and 4.85 - 5.05 {All 15 H, m, 2.46, 4.43 and 4.48 (Each s) }, 6.52 - 6.65 and 6.78 - 6.95and 7.12 - 7.55 (All 11 H, m).

{1636}

Working Example 741

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :1.08-1.88 {9 H, m (1.22 And 1.35, each 3 H, each d, J=6.0H_Z) }, 1.88 - 2.61 {11 H, m (2.33 And 2.43, each s) }, 2.61 - 4.04 and 4.31 - 4.70and 4.98 - 5.19 (All 10 H, m), 6.12 - 7.43 (7 H, m).

{1637}

Working Example 742

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :1.10-2.59 {15 H, m (2.33 And 2.45, each s) }, 2.59 - 3.09 (2 H, m), 3.09 - 4.01 and 4.43 - 4.64 (All 6 H, m),4.93 and 5.09 (All 2 H, each s), 6.24 - 7.51 (12 H, m).

【1638】

実施例 743

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-2.61[15 H,m,2.34(s)],2.61-3.02(2H,m), 3.02-4.11,4.43-4.64 及び 4.90-5.12(全 6H,m), 5.30(1H,s), 6.00-7.45(7H,m)。

【1639】

実施例 744

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.32-2.26,2.45-2.65,2.65-3.30 及び 4.85-5.12[全 11H,m,2.53(s)],6.65-6.75,6.75-7.06,7.06-7.54,7.54-7.96 及び 8.58-8.76(全 11H,m)。

【1640】

実施例 745

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.0-2.2 及び 2.7-4.8(全 28H,m), 6.15-7.35(11H,m), 10.3-10.95(1H,m)。

【1641】

実施例 747

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-1.00,1.15-2.35,2.35-4.27 及び 4.45-4.80[全 32H,m,3.38(s)],6.75-7.55(7H,m), 12.6-13.4(1H,br)。

【1642】

実施例 748

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.66-1.10,1.10-1.49,1.49-2.34,2.34-4.23 及び 4.35-4.80(全 38H,m), 6.73-7.55(7H,m), 12.6-13.5(1H,br)。

【1643】

実施例 749

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-0.96,0.96-2.22,2.22-4.30 及び 4.30-4.83[全 27H,m,4.58 及

(12 H, m) .

{1638}

Working Example 743

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :1.08-2.61 {15 H, m, 2.34 (s) }, 2.61 - 3.02 (2 H, m), 3.02 - 4. 11 and 4. 43 - 4.64and 4.90 - 5.12 (All 6 H, m), 5.30 (1 H, s), 6.00 - 7.45 (7 H, m).

{1639}

Working Example 744

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :1.32-2.26, 2.45-2.65, 2.65-3.30 and 4.85 - 5.12 {All 11 H, m, 2.53 (s) }, 6.65 - 6. 75 and 6. 75 - 7.06 and 7. 06 - 7. 54 and 7. 54 - 7.96 and 8.58 - 8.76 (All 11 H, m).

{1640}

Working Example 745

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₆);de ppm :1.0-2.2 and 2.7 - 4.8 (All 28 H, m), 6.15 - 7.35 (11 H, m), 10.3 - 10.95 (1 H, m).

{1641}

Working Example 747

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :0.75-1.00, 1.15-2.35, 2.35-4.27 and 4.45 - 4.80 {All 32 H, m, 3.38 (s) }, 6.75 - 7.55 (7 H, m), 12.6 - 13.4 (1 H, br).

{1642}

Working Example 748

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :0.66-1.10, 1.10-1.49, 1.49-2.34, 2.34-4.23 and 4.35 - 4.80 (All 38 H, m), 6.73 - 7.55 (7 H, m), 12.6 - 13.5 (1 H, br).

{1643}

Working Example 749

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :0.75-0.96, 0.96-2.22, 2.22-4.30

び 2.49(各 s)], 6.48-7.53(11H, m), 12.75-13.45(1 H, br)。

【1644】

実施例 751

の化合物

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.78-1.05, 1.15-4.30 及び 4.42-4.75[全 33H, m, 0.93, 0.99 及び 2.33(各 s)], 6.68-7.89(8H, m)。

【1645】

実施例 752

の化合物

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.52(3H, d, J=6.6Hz), 0.97(3H, d, J=6.6Hz), 1.10-2.20, 2.20-3.20 及び 3.35-4.15[全 13H, m, 2.62(s)], 6.35-6.55, 7.00-7.60 及び 7.60-8.05(全 10H, m), 8.65-8.80(1H, m)。

【1646】

実施例 753

の化合物

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.25-2.45, 2.45-4.30 及び 4.30-4.90(全 23H, m), 6.45-8.55(全 11 H, m), 8.75-9.00(1H, m)。

【1647】

実施例 754

の化合物

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.82-1.14[6H, m, (0.95 及び 1.04, 各 d, J=6.7Hz)], 1.15-1.93(1H, m), 1.95-2.59[14H, m, 2.33 及び 4.45(各 s)], 2.59-4.02, 4.45-4.67 及び 4.98-5.17(全 11H, m), 6.12-7.46(7H, m)。

【1648】

実施例 755

の化合物

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.92 及び 0.99 (全 6H, 各 t, J=7.3Hz), 1.19-2.59[18H, m, 12.33 及び 2.44(各 s)], 2.59-4.09, 4.41-4.65 及び 4.95-5.18 [全 11H, m, 3.83 及び 3.98(各 t, J=6.5Hz)], 6.11-7.45(7H, m)。

and 4.30 - 4.83 {All 27 H, m, 4.58 and 2.49 (Each s) }, 6.48 - 7.53 (11 H, m), 12.75 - 13.45(1 H, br) .

{1644}

Working Example 751

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm : 0.78-1.05, 1.15-4.30 and 4.42 - 4.75 {All 33 H, m, 0.93, 0.99 and 2.33 (Each s) }, 6.68 - 7.89 (8 H, m) .

{1645}

Working Example 752

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm : 0.52 (3 H, d, J=6.6 Hz), 0.97 (3 H, d, J=6.6 Hz), 1.10 - 2.20 and 2.20 - 3.20 and 3.35 - 4.15 {All 13 H, m, 2.62 (s) }, 6.35 - 6.55 and 7.00 - 7.60 and 7.60 - 8.05 (All 10 H, m), 8.65 - 8.80 (1 H, m) .

{1646}

Working Example 753

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm : 1.25-2.45, 2.45-4.30 and 4.30 - 4.90 (All 23 H, m), 6.45 - 8.55 (All 11 H, m), 8.75 - 9.00 (1 H, m) .

{1647}

Working Example 754

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm : 0.82-1.14 {6 H, m, (0.95 And 1.04, each d, J=6.7 Hz) }, 1.15 - 1.93 (1 H, m), 1.95 - 2.59 {14 H, m, 2.33 and 4.45 (Each s) }, 2.59 - 4.02 and 4.45 - 4.67 and 4.98 - 5.17 (All 11 H, m), 6.12 - 7.46 (7 H, m) .

{1648}

Working Example 755

compound

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm : 0.92 and 0.99 (All 6 H, each t, J=7.3 Hz), 1.19 - 2.59 {18 H, m, 12.33 and 2.44 (Each s) }, 2.59 - 4.09 and 4.41 - 4.65 and 4.95 - 5.18 {All 11 H, m, 3.83 and 3.98 (Each t, J=6.5 Hz) }, 6.11 - 7.45 (7 H, m) .

【1649】

実施例 756

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.7-0.95,0.95-2.25,2.60-4.20 及び 4.20-4.55[全 34H,m,0.8 (d,J=6.6Hz), 2.66(s)],6.75-7.95,8.29 及び 8.57 (全 8H,m,7.62,7.83,8.29 及び 8.57(各 s))。

【1650】

実施例 759

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.09-2.19 {12H,m,1.25(t,J=7.2Hz)},2.28-3.67,4.24-4.57 及び 4.68-4.98[全 10H,m,2.41(s)],6.68-7.81(11H,m), 10.26-10.64(1H,m)。

【1651】

実施例 760

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.50 及び 0.95 (全 6H,各 d,J=6.5Hz), 1.01-1.32[7H,m,1.04(3H,d,J=6.7Hz)],1.48-3.18[10H,m,2.49(s)],3.30-4.65 及び 5.46-5.72[全 5H,m,3.75(d,J=6.5Hz)],6.40-7.39(8H,m)。

【1652】

実施例 761

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.50(3H,d,J=6.5Hz), 0.85-1.29[7H,m,0.95(3H,d,J=6.5Hz), 0.99 及び 1.16(全 3H,各 t,J=5.5Hz)],1.35-2.18(10H,m), 2.19-2.58[5H,m,2.49(s)],2.58-2.78 及び 2.89-3.18(全 2H,m), 3.30-4.65 及び 5.41-5.67(全 6H,m), 6.81-7.40(8H,m)。

【1653】

実施例 764

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.64-2.12 {11H,m,0.75 及び 0.89(各 d,各 J=6.5Hz)},2.12-5.05[21H,m,2.33(s)],6.37-7.52(7H,m), 10.92-11.4

6.11 - 7.45 (7 H, m).

{1649}

Working Example 756

compound

All 8 H, m, 7.62, 7.83, 8.29 and 8.57 (Each s)).
¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);de ppm :0.7-0.95, 0.95-2.25, 2.60-4.20 and 4.20 - 4.55 {All 34 H, m, 0.8 (d, J=6.6H_Z), 2.66 (s) }, 6.75 - 7. 95 and 8. 29 and8.57

{1650}

Working Example 759

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);de ppm :1.09-2.19 {12 H, m, 1.25 (t, J=7.2H_Z) }, 2.28 - 3. 67 and 4. 24 - 4.57 and 4.68 - 4.98{All 10 H, m, 2.41 (s) }, 6.68 - 7.81 (11 H, m), 10.26 - 10.64 (1 H, m).

{1651}

Working Example 760

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :0.50 and 0.95 (All 6 H, each d, J=6.5H_Z), 1.01 - 1.32 {7 H, m, 1.04 (3 H, d, J=6.7H_Z) }, 1.48 - 3.18 {10 H, m, 2.49 (s) }, 3.30 -4.65 and 5.46 - 5.72 {All 5 H, m, 3.75 (d, J=6.5H_Z) }, 6.40 - 7.39 (8 H, m).

{1652}

Working Example 761

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :0.50 (3 H, d, J=6.5H_Z), 0.85 - 1.29 {7 H, m, 0.95 (3 H, d, J=6.5H_Z), 0.99 and 1.16 (All 3 H, each t, J=5.5H_Z) }, 1.35 - 2.18 (10 H, m), 2.19 - 2.58 {5 H, m, 2.49 (s) },2.58 - 2.78 and 2.89 - 3.18 (All 2 H, m), 3.30 - 4.65 and 5.41 - 5.67 (All 6 H, m), 6.81 -7.40 (8 H, m).

{1653}

Working Example 764

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);de ppm :0.64-2.12 {11 H, m, 0.75 and 0.89 (Each d, each J=6.5H_Z) }, 2.12 - 5.05 {21 H, m,

3(1H,m)。

【1654】

実施例 765

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃+DMSO-d₆) δ ppm:1.2-2.3(4H,m), 2.5-3.4,4.7-5.1 及び 5.3-5.6(全 4H, 各 m), 6.5-7.5(9H,m), 7.60(1H,dd,J=7.5Hz,7.5Hz), 7.95(1H,d,J=7.5Hz), 11.43(1H,s)。

【1655】

実施例 766

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.50(3H,d,J=6.6Hz), 0.76-1.40,1.50-2.18,2.18-2.70 及び 2.70-4.18(全 24H,m,3.36(s)),6.28-6.42 及び 6.82-7.54(全 8H,m)。

【1656】

実施例 767

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.50(3H,d,J=6.6Hz), 0.69-1.05,1.05-1.41,1.41-2.19,2.19-2.70 及び 2.95-4.15(全 31H,m), 6.27-6.38 及び 6.75-7.52(8H,m)。

【1657】

実施例 768

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.55-0.65,0.72-0.99,1.20-1.44,1.55-2.10,2.10-2.90,2.90-3.25 及び 3.25-4.10(全 36H,m), 6.30-6.45,6.75-6.94 及び 7.00-7.50(8H,m)。

【1658】

実施例 769

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-4.70 及び 4.89-5.12(全 26H,m,2.34(s), 4.33(t,J=5.4Hz), 4.40(t,J=5.3Hz), 6.72-7.70(7H,m)。

【1659】

2.33 (s) }, 6.37 - 7.52 (7 H, m), 10.92 - 11.43(1 H, m).

{1654}

Working Example 765

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃+DMSO -d₆);de ppm :1.2-2.3 (4 H, m), 2.5 - 3.4, 4.7 - 5.1 and 5.3 - 5.6 (All 4 H, each m), 6.5 - 7.5(9 H, m), 7.60 (1 H, dd, J=7.5Hz, 7.5Hz), 7.95 (1 H, d, J=7.5Hz), 11.43 (1 H, s).

{1655}

Working Example 766

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :0.50 (3 H, d, J=6.6Hz), 0.76 - 1.40 and 1.50 - 2.18 and 2.18 - 2.70 and 2.70 - 4.18 {All 24 H, m, 3.36 (s) }, 6.28 - 6.42 and 6.82 - 7.54 (All 8 H, m).

{1656}

Working Example 767

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :0.50 (3 H, d, J=6.6Hz), 0.69 - 1.05 and 1.05 - 1.41 and 1.41 - 2.19 and 2.19 - 2.70 and 2.95 - 4.15 (All 31 H, m), 6.27 - 6.38 and 6.75 - 7.52 (8 H, m).

{1657}

Working Example 768

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :0.55-0.65, 0.72-0.99, 1.20-1.44, 1.55-2.10, 2.10-2.90, 2.90-3.25 and 3.25 - 4.10 (All 36 H, m), 6.30 - 6.45 and 6.75 - 6.94 and 7.00 - 7.50 (8 H, m).

{1658}

Working Example 769

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :1.05-4.70 and 4.89 - 5.12 (All 26 H, m, 2.34 (s), 4.33 (t, J=5.4Hz), 4.40 (t, J=5.3Hz), 6.72 - 7.70 (7 H, m).

{1659}

実施例 770

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.61(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 0.97(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.15-1.30, 1.55-2.15, 2.25-2.70, 2.90-3.20, 3.32-3.52 及び 3.60-3.95(全 19H, m), 4.40-4.60(4H, m), 6.20-6.40, 6.51-6.52 及び 6.82-7.55(全 13H, m)。

【1660】

実施例 771

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 0.82-2.25(11H, m, 0.97(d, $J=6.6\text{Hz}$)), 2.29-4.98(21H, m, 2.43(s)), 6.49-7.79(11H, m), 10.85-11.30(1H, m)。

【1661】

実施例 773

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 1.00-2.30(7H, m, 1.28(t, $J=7.2\text{Hz}$)), 2.31-5.08(21H, m, 2.43(s), 3.76(s)), 6.48-7.81(11H, m), 10.81-11.31(1H, m)。

【1662】

実施例 774

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 1.01-2.38(4H, m), 2.39-5.02(24H, m, 2.43(s), 3.76(s), 3.81(s)), 6.49-7.78(11H, m), 10.47-11.08(1H, m)。

【1663】

実施例 775

の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 1.01-2.28(10H, m, 1.19(t, $J=7.1\text{Hz}$)), 2.29-5.02(22H, m, 2.44(s), 3.77(s), 3.81(s)), 6.49-7.81(11H, m), 9.92-10.32(1H, m)。

【1664】

実施例 777

の化合物

Working Example 770

compound

$^1\text{H-nmr}$ (200 MHz CDCl_3); δ ppm : 0.61 (3 H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 0.97 (3 H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.15 - 1.30 and 1.55 - 2.15 and 2.25 - 2.70 and 2.90 - 3.20 and 3.32 - 3.52 and 3.60 - 3.95 (All 19 H, m), 4.40 - 4.60 (4 H, m), 6.20 - 6.40 and 6.51 - 6.52 and 6.82 - 7.55 (All 13 H, m).

{1660}

Working Example 771

compound

11 H, m, 0.97 (d, $J=6.6\text{Hz}$), 2.29 - 4.98 (21 H, m, 2.43 (s)), 6.49 - 7.79 (11 H, m), 10.85 - 11.30 (1 H, m).
 $^1\text{H-nmr}$ (200 MHz DMSO-d_6); δ ppm : 0.82-2.25

{1661}

Working Example 773

compound

$^1\text{H-nmr}$ (200 MHz DMSO-d_6); δ ppm : 1.00-2.30 {7 H, m, 1.28 (t, $J=7.2\text{Hz}$)}, 2.31 - 5.08 {21 H, m, 2.43 (s), 3.76 (s)}, 6.48 - 7.81 (11 H, m), 10.81 - 11.31 (1 H, m).

{1662}

Working Example 774

compound

$^1\text{H-nmr}$ (200 MHz DMSO-d_6); δ ppm : 1.01-2.38 (4 H, m), 2.39 - 5.02 {24 H, m, 2.43 (s), 3.76 (s), 3.81 (s)}, 6.49 - 7.78 (11 H, m), 10.47 - 11.08 (1 H, m).

{1663}

Working Example 775

compound

$^1\text{H-nmr}$ (200 MHz DMSO-d_6); δ ppm : 1.01-2.28 {10 H, m, 1.19 (t, $J=7.1\text{Hz}$)}, 2.29 - 5.02 {22 H, m, 2.44 (s), 3.77 (s), 3.81 (s)}, 6.49 - 7.81 (11 H, m), 9.92 - 10.32 (1 H, m).

{1664}

Working Example 777

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.21-3.18,3.58-3.85,4.15-4.40 及び 4.82-5.15[全 25H,m,2.63(t,J=5.73Hz), 4.27(t,J=5.8Hz)],6.14-7.01,7.18-7.49 及び 7.75-7.92[全 7H,m,7.85(d,J=8.5Hz)]。

【1665】

実施例 778

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.96(6H,d,J=10.7Hz), 1.21-4.11,4.31-4.59 及び 5.01-5.22[全 21H,m,2.41(s), 3.70(s), 3.92(d,J=6.6Hz)],6.49-7.67 及び 7.80-8.05[全 8H,m,7.92(d,J=8.4Hz)]。

【1666】

実施例 779

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-1.86,1.86-2.29,2.40-2.63,2.63-3.16,3.32-3.52 及び 4.85-5.08[全 11H,m,2.52(s), 2.57(s)],6.56-6.68 及び 6.82-7.56(6H,m), 8.86 及び 8.97(全 2H,各 s), 9.17 及び 9.23(全 1H,各 s)。

【1667】

実施例 780

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.38-1.66,1.85-2.22,2.62-3.16 及び 4.90-5.15(8H,m), 3.71(3H,s), 6.58-6.70(1H,m), 6.70-6.82(1H,m), 6.82-7.00(2H,m), 7.12-7.31(2H,m), 7.50-7.80(3H,m), 7.60-7.70(1H,m)。

【1668】

実施例 781

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.20,2.65-3.15 及び 4.92-5.13(全 8H,m), 3.67(3H,s), 6.55-6.84(2H,m), 6.84-7.00(2H,m), 7.00-7.19(1H,m), 7.19-7.34(2H,m), 7.73-7.85(1H,m), 8.48-8.60(1H,m), 8.60-8.72(1H,m)。

【1669】

実施例 783

の化合物

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :1.21-3.18, 3.58-3.85, 4.15-4.40 and 4.82 - 5.15 {All 25 H, m, 2.63 (t, J=5.73H_Z), 4.27 (t, J=5.8H_Z)}, 6.14 - 7.01 and 7.18 - 7.49and 7.75 - 7.92 {All 7 H, m, 7.85 (d, J=8.5H_Z)}.

{1665}

Working Example 778

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :0.96 (6 H, d, J=10.7H_Z), 1.21 - 4.11 and 4.31 - 4.59 and 5.01 - 5.22{All 21 H, m, 2.41 (s), 3.70 (s), 3.92 (d, J=6.6H_Z)}, 6.49 - 7.67 and 7.80 - 8.05 {All 8 H, m, 7.92 (d, J=8.4H_Z)}.

{1666}

Working Example 779

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :1.35-1.86, 1.86-2.29, 2.40-2.63, 2.63-3.16, 3.32-3.52 and 4.85 - 5.08 {All 11 H, m, 2.52 (s), 2.57 (s)}, 6.56 - 6.68 and 6.82 - 7.56 (6 H, m), 8.86 and 8.97 (All 2 H, each s), 9.17 and 9.23 (All 1 H, each s).

{1667}

Working Example 780

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :1.38-1.66, 1.85-2.22, 2.62-3.16 and 4.90 - 5.15 (8 H, m), 3.71 (3 H, s), 6.58 - 6.70 (1 H, m), 6.70 - 6.82 (1 H, m), 6.82 - 7.00 (2 H, m), 7.12 - 7.31 (2 H, m), 7.50 - 7.80 (3 H, m), 7.60 - 7.70(1 H, m).

{1668}

Working Example 781

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z,₃);de ppm :1.35-2.20, 2.65-3.15 and 4.92 - 5.13 (All 8 H, m), 3.67 (3 H, s), 6.55 - 6.84 (2 H, m), 6.84 - 7.00 (2 H, m), 7.00 - 7.19 (1 H, m), 7.19 - 7.34 (2 H, m), 7.73 - 7.85 (1 H, m), 8.48 - 8.60(1 H, m), 8.60 - 8.72 (1 H, m).

{1669}

Working Example 783

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-4.68 及び 5.00-5.19[全 27H,m,2.36(s), 3.75(s)],6.48-7.59 (7H,m)。

【1670】

実施例 784

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-2.21,2.55-3.19,3.41-3.55,3.65-3.80,3.95-4.23 及び 4.89-5.12[全 31H,m,1.45(s), 3.73(s)],6.51-6.74,6.82-6.95,7.19-7.35 及び 7.80-7.90[全 7H,m,7.84(d,J=8.4Hz)]。

【1671】

実施例 785

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.0-4.0 及び 4.0-5.2(全 29H,m), 6.1-8.2(全 11H,m)。

【1672】

実施例 786

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.0-1.4,1.4-4.0 及び 4.0-5.2(全 33H,m), 6.15-6.35 及び 6.6-8.25 (全 7H,m), 12.4-13.4(1H,m)。

【1673】

実施例 787

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-1.6,1.6-2.2, 2.6-3.75 及び 3.9-4.6(全 28H,m), 6.5-7.6 及び 7.8-8.2(全 12H,m), 10.8-11.2(1H,m)。

【1674】

実施例 788

の化合物

¹H-NMR(250MHz,CDCl₃) δ ppm:1.25-4.0,4.35-4.55 及び 5.0-5.20[全 30H,m,2.33(s), 2.82(s), 3.63(s)],6.55-7.55[全 6H,m,6.6(d,J=6.6Hz), 6.96(d,J=6.6Hz), 7.20(d,J=6.6Hz), 7.49(s)]。

【1675】

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.19-4.68 and 5.00 - 5.19 {All 27 H, m, 2.36 (s), 3.75 (s) }, 6.48 - 7.59 (7 H, m).

{1670}

Working Example 784

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.05-2.21, 2.55-3.19, 3.41-3.55, 3.65-3.80, 3.95-4.23 and 4.89 - 5.12 {All 31 H, m, 1.45 (s), 3.73 (s) }, 6.51 - 6.74 and 6.82 - 6.95 and 7.19 - 7.35 and 7.80 - 7.90 {All 7 H, m, 7.84 (d, J=8.4H_Z) }.

{1671}

Working Example 785

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.0-4.0 and 4.0 - 5.2 (All 29 H, m), 6.1 - 8.2 (All 11 H, m).

{1672}

Working Example 786

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.0-1.4, 1.4- 4.0 and 4.0 - 5.2 (All 33 H, m), 6.15 - 6.35 and 6.6 - 8.25 (All 7 H, m),12.4 - 13.4 (1 H, m).

{1673}

Working Example 787

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.2- 1.6, 1.6-2.2, 2.6-3.75 and 3.9 - 4.6 (All 28 H, m), 6.5 - 7.6 and 7.8-8.2 (All 12 H, m), 10.8 - 11.2(1 H, m).

{1674}

Working Example 788

compound

¹H-nmr (250 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.25-4.0, 4.35-4.55 and 5.0 - 5.20 {All 30 H, m, 2.33 (s), 2.82 (s), 3.63 (s) }, 6.55 - 7.55 {All 6 H, m, 6.6 (d, J=6.6H_Z), 6.96 (d, J=6.6H_Z), 7.20 (d, J=6.6H_Z), 7.49 (s) }.

{1675}

実施例 789

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.4-1.4,1.4-2.4, 2.4-2.85,2.85-3.3,3.3-5.0 及び 5.0-5.8(全 29H,m), 6.29 及び 6.5-7.5[全 6H,m,6.29(d,J=8.4Hz)]。

【1676】

実施例 790

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-1.69,1.78-2.26,2.53-3.14,3.30-3.81,4.29-4.51 及び 4.90-5.18[全 15H,m,2.98(t,J=5.3Hz), 4.39(t,J=5.3Hz), 3.72(s)],6.45-7.35,7.65-7.92 及び 8.40-8.65(全 11 H,m)。

【1677】

実施例 792

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-0.98,1.21-2.20,2.42-4.19 及び 4.85-5.19[全 25H,m,2.60(s), 3.73(s)],6.45-6.75 及び 6.80-7.00(全 5H,m), 7.23(1H,d,J=2.4Hz), 7.81(1H,d,J=6.6Hz)]。

【1678】

実施例 794

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-3.95,4.41-4.63 及び 4.95-5.15[全 28H,m,1.49(s), 1.58(s), 2.38(s)],6.75-7.92(7H,m)。

【1679】

実施例 795

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-4.05,4.45-4.70 及び 4.81-5.13[全 27H,m,2.40(s), 1.25(d,J=6.2Hz), 1.31(d,J=6.3Hz)],6.60-7.82(8H,m)。

【1680】

実施例 796

の化合物

Working Example 789

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃;de ppm :0.4- 1.4, 1.4- 2.4, 2.4- 2.85, 2.85-3.3, 3.3- 5.0 and 5.0 - 5.8 (All 29 H, m), 6.29 and 6.5 - 7.5 {All 6 H, m, 6.29 (d, J=8.4H_Z) }.

{1676}

Working Example 790

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃;de ppm :1.35-1.69, 1.78-2.26, 2.53-3.14, 3.30-3.81, 4.29-4.51 and 4.90 - 5.18 {All 15 H, m, 2.98 (t, J=5.3H_Z), 4.39 (t, J=5.3H_Z), 3.72 (s) }, 6.45 - 7.35 and 7.65 - 7.92and 8.40 - 8.65 (All 11 H, m).

{1677}

Working Example 792

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃;de ppm :0.75-0.98, 1.21-2.20, 2.42-4.19 and 4.85 - 5.19 {All 25 H, m, 2.60 (s), 3.73 (s) }, 6.45 - 6.75 and 6.80 - 7.00 (All 5 H, m),7.23 (1 H, d, J=2.4H_Z), 7.81 (1 H, d, J=6.6H_Z) }.

{1678}

Working Example 794

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃;de ppm :1.11-3.95, 4.41-4.63 and 4.95 - 5.15 {All 28 H, m, 1.49 (s), 1.58 (s), 2.38 (s) }, 6.75 - 7.92 (7 H, m).

{1679}

Working Example 795

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃;de ppm :1.11-4.05, 4.45-4.70 and 4.81 - 5.13 {All 27 H, m, 2.40 (s), 1.25 (d, J=6.2H_Z), 1.31 (d, J=6.3H_Z) }, 6.60 - 7.82 (8 H, m).

{1680}

Working Example 796

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.18,2.18-4.20,4.25-4.70 及び 4.90-5.15[全 24H,m,3.85(s)],6.55-7.15,7.15-7.60 及び 7.70-8.10(全 21H,m)。

【1681】

実施例 797

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03-1.40,1.50-2.23,2.23-2.58,2.58-4.05,4.05-4.30 及び 4.52-4.73[全 24H,m,1.60(s), 2.13(s)],6.55-7.05 及び 7.05-7.50(全 20H,m)。

【1682】

実施例 798

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.30-2.20,2.62-3.18 及び 4.85-5.05(全 8H,m), 3.68(3H,brs), 6.67-6.90 及び 7.00-7.50(全 7H,m), 7.75-7.85(1H,m), 8.50-8.65(1H,m), 8.65-8.85(1H,m)。

【1683】

実施例 799

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.30-1.80,1.80-2.20,2.62-2.93,2.93-3.20 及び 4.82-5.03(全 8H,m), 3.71(3H,s), 6.67-6.85(2H,m), 7.10-7.48(5H,m), 7.60-7.80(2H,m), 8.60-8.70(1H,m)。

【1684】

実施例 800

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.33-1.65,1.80-2.20,2.62-2.70,2.95-3.20,3.50-3.90 及び 4.85-5.02[全 11H,m,3.74(s)],5.02-6.00(1H,br), 6.65-7.05(3H,m), 7.05-7.50(3H,m), 7.72-7.92(2H,m), 8.68-8.83(2H,m)。

【1685】

実施例 801

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.03-2.04(10H,m), 2.31-3.88,4.29-4.54 及び 4.84-5.07[全 19H,m,2.43(s), 3.77(s)],6.50-7.78(11H,m), 8.44-8.69(1H,m), 9.91-10.27(1H,m)。

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.35-2.18, 2.18-4.20, 4.25-4.70 and 4.90 - 5.15 {All 24 H, m, 3.85 (s) }, 6.55 - 7.15 and 7.15 - 7.60 and 7.70 - 8.10 (All 21 H, m).

{1681}

Working Example 797

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.03-1.40, 1.50-2.23, 2.23-2.58, 2.58-4.05, 4.05-4.30 and 4.52 - 4.73 {All 24 H, m, 1.60 (s) , 2.13 (s) }, 6.55 - 7.05 and 7.05 - 7.50 (All 20 H, m).

{1682}

Working Example 798

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.30-2.20, 2.62-3.18 and 4.85 - 5.05 (All 8 H, m), 3.68 (3 H, brs), 6.67 - 6.90 and 7.00 - 7.50 (All 7 H, m), 7.75 - 7.85 (1 H, m), 8.50 - 8.65 (1 H, m), 8.65 - 8.85 (1 H, m).

{1683}

Working Example 799

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.30-1.80, 1.80-2.20, 2.62-2.93, 2.93-3.20 and 4.82 - 5.03 (All 8 H, m), 3.71 (3 H, s), 6.67 - 6.85 (2 H, m), 7.10 - 7.48 (5 H, m), 7.60 - 7.80 (2 H, m), 8.60 - 8.70 (1 H, m).

{1684}

Working Example 800

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.33-1.65, 1.80-2.20, 2.62-2.70, 2.95-3.20, 3.50-3.90 and 4.85 - 5.02 {All 11 H, m, 3.74 (s) }, 5.02 - 6.00 (1 H, br), 6.65 - 7.05 (3 H, m), 7.05 - 7.50 (3 H, m), 7.72 - 7.92 (2 H, m), 8.68 - 8.83 (2 H, m).

{1685}

Working Example 801

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
DMSO-d₆);de ppm :1.03-2.04 (10 H, m), 2.31 - 3.88 and 4.29 - 4.54 and 4.84 - 5.07 {All 19 H, m, 2.43 (s) , 3.77 (s) }, 6.50 - 7.78 (11 H, m), 8.44 - 8.69 (1 H, m), 9.91 -

JP1997221476A

1997-8-26

8.69(1H,m), 9.91-10.27(1H,m)。

【1686】

実施例 802

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.05-2.36 (全 10H,m,1.18(t,J=7.0Hz), 2.48-4.54 及び 4.79-5.21[全 19H,m,3.60(s)],6.67-7.62(11H,m), 10.04-10.39(1H,m)。

【1687】

実施例 803

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.05-2.10(10H,m), 2.39-3.94,4.18-4.49 及び 4.88-5.12[全 16H,m,3.58(s)],6.69-7.70(11H,m), 8.34-8.71(1H,m), 10.00-10.34(1H,m)。

【1688】

実施例 804

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.00-2.28 [10H,m,1.23(t,J=7.2Hz)],2.42-4.13,4.26-4.52 及び 4.69-4.91(全 19H,m), 6.76-7.85(11H,m), 10.09-10.48 及び 11.10-11.26(全 1H,m)。

【1689】

実施例 805

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.99-2.06 [10H,m,1.20(t,J=7.0Hz)],2.38-4.08,4.25-4.52 及び 4.72-4.92(全 16H,m), 6.78-7.84(11H,m), 8.43-8.68(1H,m), 10.09-10.45(1H,m)。

【1690】

実施例 806

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.03-2.11(4H,m), 2.34(3H,s), 2.44-4.79 及び 4.88-5.10(全 16H,m), 6.12-8.03(11H,m), 11.08-11.55(1H,m)。

【1691】

10.27 (1 H, m).

{1686}

Working Example 802

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO -d₆);de ppm :1.05-2.36 (All 10 H, m, 1.18 (t, J=7.0H_Z), 2.48 - 4.54 and 4.79 - 5.21 {All 19 H, m, 3.60 (s) }, 6.67 - 7.62 (11 H, m),10.04 - 10.39 (1 H, m).)

{1687}

Working Example 803

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO -d₆);de ppm :1.05-2.10 (10 H, m), 2.39 - 3.94 and 4.18 - 4.49 and 4.88 - 5.12 {All 16 H, m, 3.58 (s) }, 6.69 - 7.70 (11 H, m), 8.34 - 8.71 (1 H, m), 10.00 - 10.34 (1 H, m).

{1688}

Working Example 804

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO -d₆);de ppm :1.00-2.28 {10 H, m, 1.23 (t, J=7.2H_Z), 2.42 - 4.13 and 4.26 - 4.52 and 4.69 - 4.91(All 19 H, m), 6.76 - 7.85 (11 H, m), 10.09 - 10.48 and 11.10 - 11.26 (All 1 H, m).

{1689}

Working Example 805

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO -d₆);de ppm :0.99-2.06 {10 H, m, 1.20 (t, J=7.0H_Z), 2.38 - 4.08 and 4.25 - 4.52 and 4.72 - 4.92(All 16 H, m), 6.78 - 7.84 (11 H, m), 8.43 - 8.68 (1 H, m), 10.09 - 10.45 (1 H, m).

{1690}

Working Example 806

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO -d₆);de ppm :1.03-2.11 (4 H, m), 2.34 (3 H, s), 2.44 - 4.79 and 4.88 - 5.10 (All 16 H, m), 6.12 - 8.03 (11 H, m), 11.08 - 11.55 (1 H, m).

{1691}

実施例 807

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.03-2.13(10H,m), 2.22-3.83,4.17-4.48 及び 4.88-5.10[全 16H,m,2.35(s)],6.58-7.90(11H,m), 8.39-8.81(1H,m), 10.20-10.65(1H,m)。

【1692】

実施例 808

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.10-2.28(4H,m), 2.52-4.68 及び 4.87-5.10[全 22H,m,3.51(s), 3.65(s)],6.11-6.29 及び 6.42-7.65(全 10H,m), 11.07-11.48(1H,brs)。

【1693】

実施例 809

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.95-2.26(10H,m), 2.38-4.08,4.20-4.52 及び 4.78-5.08[全 19H,m,3.58(s), 3.75(s)],6.62-7.62(10H,m), 8.36-8.68(1H,m), 9.82-10.20(1H,m)。

【1694】

実施例 810

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.07-2.29(4H,m), 2.30-4.78 及び 4.87-5.10[全 22H,m,3.51(s), 3.65(s)],6.11-6.29 及び 6.42-7.63(全 10H,m), 11.13-11.58(1H,brs)。

【1695】

実施例 811

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.03-2.30(10H,m), 2.40-4.00,4.18-4.76 及び 4.83-5.08[全 19H,m,3.58(s), 3.75(s)],6.63-7.64(10H,m), 8.34-8.71(1H,m), 9.92-10.39(1H,m)。

【1696】

実施例 812

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.05-2.09(4H,m), 2.30(3H,m), 2.58-4.71 及び 4.88-5.18[全

Working Example 807

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO-d₆);de ppm :1.03-2.13 (10 H, m), 2.22 - 3. 83 and 4. 17 - 4.48 and 4.88 - 5.10 {All 16 H, m, 2.35 (s) }, 6.58 - 7.90 (11 H, m), 8.39 - 8.81 (1 H, m), 10.20 - 10.65 (1 H, m).

{1692}

Working Example 808

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO-d₆);de ppm :1.10-2.28 (4 H, m), 2.52 - 4.68 and 4.87 - 5.10 {All 22 H, m, 3.51 (s), 3.65 (s) }, 6.11 - 6.29 and 6.42 - 7.65 (All 10 H, m), 11.07 - 11.48 (1 H, brs).

{1693}

Working Example 809

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO-d₆);de ppm :0.95-2.26 (10 H, m), 2.38 - 4. 08 and 4. 20 - 4.52 and 4.78 - 5.08 {All 19 H, m, 3.58 (s), 3.75 (s) }, 6.62 - 7.62 (10 H, m), 8.36 - 8.68 (1 H, m), 9.82 - 10.20 (1 H, m).

{1694}

Working Example 810

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO-d₆);de ppm :1.07-2.29 (4 H, m), 2.30 - 4.78 and 4.87 - 5.10 {All 22 H, m, 3.51 (s), 3.65 (s) }, 6.11 - 6.29 and 6.42 - 7.63 (All 10 H, m), 11.13 - 11.58 (1 H, brs).

{1695}

Working Example 811

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO-d₆);de ppm :1.03-2.30 (10 H, m), 2.40 - 4. 00 and 4. 18 - 4.76 and 4.83 - 5.08 {All 19 H, m, 3.58 (s), 3.75 (s) }, 6.63 - 7.64 (10 H, m), 8.34 - 8.71 (1 H, m), 9.92 - 10.39 (1 H, m).

{1696}

Working Example 812

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO-d₆);de ppm :1.05-2.09 (4 H, m), 2.30 (3 H,

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.96-2.19 [10H,m,1.19(t,J=7.0Hz)],2.31(3H,s), 2.55-4.69 及び 4.82-5.08[全 19H,m,3.59(s)],6.12-7.63(10 H,m), 10.19-10.52 及び 11.00-11.30(全 1H,m)。

【1697】

実施例 813

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.96-2.19 [10H,m,1.19(t,J=7.0Hz)],2.31(3H,s), 2.55-4.69 及び 4.82-5.08[全 19H,m,3.59(s)],6.12-7.63(10 H,m), 10.19-10.52 及び 11.00-11.30(全 1H,m)。

【1698】

実施例 814

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.30,2.50-3.85,4.48-4.67 及び 5.06-5.24[全 15H,m,2.56(s) 及び 3.72(s)],6.50-6.72(1H,m), 6.72-7.95(9H, m), 8.57-8.75(1H,m)。

【1699】

実施例 816

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.21(4H, m), 2.33-2.55,3.09-3.87 及び 4.39-4.62[全 11H, m,2.45 及び 3.69(各 s)],2.60-3.05(2H,m), 4.81-5.19[2H,m,4.93 及び 5.09(各 s)],6.25-7.53(12H, m)。

【1700】

実施例 817

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.19(4H, m), 2.44 及び 2.47(全 3H,各 s), 2.11-3.08(2H, m), 3.08-3.90,4.39-4.62 及び 4.79-5.31[全 7H,4.89 及び 5.06(全 2H,各 s)],6.25-7.52(12H,m)。

【1701】

実施例 818

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.17[全 10H,m,1.24 及び 1.35(各 d,J=6.0Hz)],2.32-2.59[3 H,m,2.43(s)],2.61-3.32(3H,m), 3.41-3.92[6H,m, 3.70(s)],4.29-4.63 及び 5.01-5.22(全 2H,m), 6.18-7.42(7H,m)。

m), 2.58 - 4.71 and 4.88 - 5.18 {All 19 H, m, 3.57 (s) }, 6.12 - 7.68 (10 H, m), 11.00 - 11.50 (1 H, brs).

{1697}

Working Example 813

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO -d₆);de ppm :0.96-2.19 {10 H, m, 1.19 (t, J=7.0H_Z) }, 2.31 (3 H, s), 2.55 - 4.69 and 4.82 - 5.08 {All 19 H, m, 3.59 (s) }, 6.12 -7.63 (10 H, m), 10.19 - 10.52 and 11.00 - 11.30 (All 1 H, m).

{1698}

Working Example 814

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, CDCl₃);de ppm :1.15-2.30, 2.50-3.85, 4.48-4.67 and 5.06 - 5.24 {All 15 H, m, 2.56 (s) and 3.72 (s) }, 6.50 - 6.72 (1 H, m), 6.72 - 7.95 (9 H, m),8.57 - 8.75 (1 H, m).

{1699}

Working Example 816

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, CDCl₃);de ppm :1.15-2.21 (4 H, m), 2.33 - 2.55 and 3.09 - 3.87 and 4.39 - 4.62 {All 11 H, m, 2.45 and 3.69 (Each s) }, 2.60 - 3.05 (2 H, m), 4.81 - 5.19 {2 H, m, 4.93 and 5.09 (Each s) }, 6.25 - 7.53 (12 H, m).

{1700}

Working Example 817

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, CDCl₃);de ppm :1.15-2.19 (4 H, m), 2.44 and 2.47 (All 3 H, each s), 2.11 - 3.08 (2 H, m), 3.08 - 3.90 and 4.39 - 4.62 and 4.79 - 5.31 {All 7 H, 4.89 and 5.06 (All 2 H, each s) }, 6.25 - 7.52 (12 H, m).

{1701}

Working Example 818

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, CDCl₃);de ppm :1.12-2.17 {All 10 H, m, 1.24 and 1.35 (Each d, J=6.0H_Z) }, 2.32 - 2.59 {3 H, m, 2.43 (s) }, 2.61 - 3.32 (3 H, m), 3.41 - 3.92 {6 H, m, 3.70 (s) },4.29 - 4.63 and 5.01 - 5.22 (All 2 H, m), 6.18 - 7.42 (7 H, m).

【1702】

実施例 819

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.09-2.22[10 H,m,1.22 及び 1.35(各 d,J=6.0Hz)],2.30-2.58[3 H,m,2.43 及び 2.47(各 s)],2.11-4.01(4H,m), 4.2 8-4.70 及び 4.99-5.22(全 2H,m), 6.13-7.48(8H,m)。

【1703】

実施例 820

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-1.00,1.00-2.20,2.60-3.05,3.05-3.43,3.43-3.96 及び 4.45-4.6 2[全 24H,m,1.59(s), 3.19(s)及び 3.69(s)],6.80-7.50(7H,m)。

【1704】

実施例 821

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.70-1.00,1.10-2.20,2.60-3.95,4.45-4.65 及び 5.02-5.15(全 21H,m), 6.80-7.55(7H,m)。

【1705】

実施例 822

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.60-1.05,1.15-2.20,2.60-3.05,3.15-3.95,4.45-4.60 及び 5.02-5.1 5(全 30H,m), 6.72-7.60(7H,m)。

【1706】

実施例 823

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.63-1.00,1.10-2.20,2.60-3.95,4.45-4.60 及び 5.00-5.20(全 27H,m), 6.68-7.58(7H,m)。

【1707】

実施例 825

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.20,2.35-2.60,2.60-3.85 及び 4.25-4.65(全 16H,m), 6.40-6.

{1702}

Working Example 819

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.09-2.22 {10 H, m, 1.22 and 1.35 (Each d, J=6.0H_Z) }, 2.30 - 2.58 {3 H, m, 2.43 and 2.47 (Each s) }, 2.11 - 4.01 (4 H, m), 4.28 - 4.70 and 4.99 - 5.22 (All 2 H, m), 6.13 - 7.48 (8 H, m).

{1703}

Working Example 820

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :0.75-1.00, 1.00-2.20, 2.60-3.05, 3.05-3.43, 3.43-3.96 and 4.45 - 4.62 {All 24 H, m, 1.59 (s), 3.19 (s) and 3.69 (s) }, 6.80 - 7.50 (7 H, m).

{1704}

Working Example 821

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :0.70-1.00, 1.10-2.20, 2.60-3.95, 4.45-4.65 and 5.02 - 5.15 (All 21 H, m), 6.80 - 7.55 (7 H, m).

{1705}

Working Example 822

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :0.60-1.05, 1.15-2.20, 2.60-3.05, 3.15-3.95, 4.45-4.60 and 5.02 - 5.15 (All 30 H, m), 6.72 - 7.60 (7 H, m).

{1706}

Working Example 823

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :0.63-1.00, 1.10-2.20, 2.60-3.95, 4.45-4.60 and 5.00 - 5.20 (All 27 H, m), 6.68 - 7.58 (7 H, m).

{1707 }

Working Example 825

compound

¹H-nmr (200 MH_Z,
CDCl₃);de ppm :1.20-2.20, 2.35-2.60, 2.60-3.85

66(1H,m), 6.70-7.55(11H,m)。

【1708】

実施例 826

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.25,2.25-3.26,3.26-3.90 及び 4.50-4.70[全 12H,m,2.61(s)],6.72-6.85(1H,m), 6.85-6.97(1H,m), 7.00-7.35(3H,m), 7.35-7.45(1H,d,J=8.2Hz), 7.56-7.78(2H,m), 7.85-8.12(2H,m), 8.20-8.38(1H,m), 8.70-8.80(1H,m)。

【1709】

実施例 827

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.4(4H,m), 2.7-3.8,4.4-4.7 及び 4.9-5.2(全 5H,各 m), 6.8-8.4(7H,m)。

【1710】

実施例 828

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.30(4H,m), 2.35-4.08,4.40-4.64 及び 4.92-5.20[全 13H,m,2.52(s), 3.72(s), 5.08(s)],6.48-7.62(16H,m)。

【1711】

実施例 829

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.26,2.32-3.69 及び 4.81-5.20[全 13H,m,2.49(s), 5.07(s)], 6.57-7.63(16H,m)。

【1712】

実施例 833

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.86,0.93,1.07, 1.15-2.15,2.60-3.80 及び 4.35-4.60[全 23H,m,0.86(d,J=6.6Hz), 0.93(d,J=6.6Hz), 1.07(t,J=7Hz)], 6.75-7.60[全 7H,m],8.25-8.80(1H,m)。

【1713】

and 4.25 - 4.65 (All 16 H, m), 6.40 - 6.66 (1 H, m), 6.70 - 7.55 (11 H, m).

{1708}

Working Example 826

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃); δ ppm :1.20-2.25, 2.25-3.26, 3.26-3.90 and 4.50 - 4.70 {All 12 H, m, 2.61 (s) }, 6.72 - 6.85 (1 H, m), 6.85 - 6.97 (1 H, m),7.00 - 7.35 (3 H, m), 7.35 - 7.45 (1 H, d, J=8.2Hz), 7.56 - 7.78 (2 H, m), 7.85 - 8.12 (2 H, m), 8.20 - 8.38 (1 H, m), 8.70 - 8.80 (1 H, m).

{1709}

Working Example 827

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃); δ ppm :1.2- 2.4 (4 H, m), 2.7 - 3.84.4 - 4.7 and 4.9 - 5.2 (All 5 H, each m), 6.8 - 8.4(7 H, m).

{1710}

Working Example 828

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃); δ ppm :1.13-2.30 (4 H, m), 2.35 - 4.08 and 4.40 - 4.64 and 4.92 - 5.20{All 13 H, m, 2.52 (s), 3.72 (s), 5.08 (s) }, 6.48 - 7.62 (16 H, m).

{1711}

Working Example 829

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃); δ ppm :1.13-2.26, 2.32-3.69 and 4.81 - 5.20 {All 13 H, m, 2.49 (s), 5.07 (s) }, 6.57 - 7.63 (16 H, m).

{1712}

Working Example 833

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃); δ ppm :0.86, 0.93, 1.07, 1.15-2.15, 2.60-3.80 and 4.35 - 4.60 {All 23 H, m, 0.86 (d, J=6.6Hz), 0.93 (d, J=6.6Hz), 1.07 (t, J=7Hz), 6.75 - 7.60 {All 7 H, m }, 8.25 - 8.80 (1 H, m).

{1713}

実施例 834

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.15,2.55-3.85,4.35-4.55 及び 4.67[全 15H,m,4.67(s)],6.70-7.40,7.44 及び 7.50-7.90[全 12H,m,7.44(s)]。

【1714】

実施例 835

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.24,2.39-2.62,2.63-3.18,3.29-3.99,4.06-4.63 及び 4.83-5.11[全 15H,m,2.49(s), 3.81(t,J=6.0Hz)],6.58-7.62(11H,m)。

【1715】

実施例 836

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.67-1.03,1.05-2.54,2.55-4.28,4.41-4.63 及び 5.00-5.21[全 24H,m,0.78(d,J=6.6Hz), 0.92(d,J=6.6Hz), 2.28(d,J=7.2Hz), 2.43(s), 3.71(s)],6.40-7.41(7H,m)。

【1716】

実施例 838

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.96 及び 1.04(全 6H,各 d,J=6.7Hz), 1.18-2.20(4H,m), 2.44 及び 2.48(全 3H,各 s), 2.61-3.31,3.39-4.16 及び 5.02-5.27(全 8H,m), 6.19-7.42(8H,m)。

【1717】

実施例 839

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.92 及び 0.99(全 3H,各 t,J=7.2Hz), 1.15-2.22(8H,m), 2.43 及び 2.47(全 3H,各 s), 2.62-3.31,3.36-4.09,4.38-4.65 及び 5.01-5.23[全 7H,m,(3.82 及び 3.97(各 t,J=6.5Hz), 6.17-7.41(8H,m)。)]

【1718】

実施例 840

Working Example 834

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :1.20-2.15, 2.55-3.85, 4.35-4.55 and 4.67 {All 15 H, m, 4.67 (s) }, 6.70 - 7.40 and 7.44 and 7.50 - 7.90 {All 12 H, m, 7.44 (s) }.

{1714}

Working Example 835

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :1.35-2.24, 2.39-2.62, 2.63-3.18, 3.29-3.99, 4.06-4.63 and 4.83 - 5.11 {All 15 H, m, 2.49 (s) }, 3.81 (t, J=6.0H_Z) }, 6.58 - 7.62 (11 H, m).

{1715}

Working Example 836

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :0.67-1.03, 1.05-2.54, 2.55-4.28, 4.41-4.63 and 5.00 - 5.21 {All 24 H, m, 0.78 (d, J=6.6H_Z), 0.92 (d, J=6.6H_Z), 2.28 (d, J=7.2H_Z), 2.43 (s) }, 3.71 (s) }, 6.40 - 7.41 (7 H, m).

{1716}

Working Example 838

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :0.96 and 1.04 (All 6 H, each d, J=6.7H_Z), 1.18 - 2.20 (4 H, m), 2.44 and 2.48 (All 3 H, each s), 2.61 - 3.31 and 3.39 - 4.16 and 5.02 - 5.27 (All 8 H, m), 6.19 - 7.42 (8 H, m).

{1717}

Working Example 839

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);de ppm :0.92 and 0.99 (All 3 H, each t, J=7.2H_Z), 1.15 - 2.22 (8 H, m), 2.43 and 2.47 (All 3 H, each s), 2.62 - 3.31 and 3.36 - 4.09 and 4.38 - 4.65 and 5.01 - 5.23 {All 7 H, m, (3.82 And 3.97 (Each t, J=6.5H_Z), 6.17 - 7.41 (8 H, m).) }

{1718}

Working Example 840

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.65-0.98, 1.04-2.12,2.13-3.70,4.26-4.51 及び 4.81-5.02[全 21H,m,0.75(d,J=6.5Hz), 0.89(d,J=6.5Hz), 2.27 (d,J=7.1Hz), 2.33(s)],6.38-7.42(7H,m), 12.14-12.42(1H,m)。

【1719】

実施例 841

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.85-2.22,2.55-3.31,3.41-3.80,4.05-4.31 及び 4.41-4.62[全 25H, m,3.69(s)],6.71-7.70(7H,m)。

【1720】

実施例 842

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.82-1.03,1.15-2.20 及び 2.45-4.62[全 22H,m,0.93(s)],6.48-8.21 (8H,m)。

【1721】

実施例 843

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-2.41,2.56-4.65 及び 4.90-5.16(全 15H,m), 6.52-7.69(7H, m), 9.39-10.05(1H,m)。

【1722】

実施例 844

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-4.01 及び 4.48-4.72[全 23H,m,2.33(s)],5.10(2H,d,J=10.3Hz), 6.43-7.64(16H,m)。

【1723】

実施例 845

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.09-4.20,4.50-4.70 及び 4.96-5.16[全 23H,m,2.36(s)],6.41-7.48 (12H,m)。

【1724】

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);de ppm :0.65-0.98, 1.04-2.12, 2.13-3.70, 4.26-4.51 and 4.81 - 5.02 {All 21 H, m, 0.75 (d, J=6.5H_Z), 0.89 (d, J=6.5H_Z), 2.27 (d, J=7.1H_Z), 2.33 (s) }, 6.38 - 7.42 (7 H, m), 12.14 - 12.42(1 H, m).

{1719}

Working Example 841

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :0.85-2.22, 2.55-3.31 , 3.41-3.80, 4.05-4.31 and 4.41 - 4.62 {All 25 H, m, 3.69 (s) }, 6.71 - 7.70 (7 H, m).

{1720}

Working Example 842

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :0.82-1.03, 1.15-2.20 and 2.45 - 4.62 {All 22 H, m, 0.93 (s) }, 6.48 - 8.21 (8 H, m).

{1721}

Working Example 843

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.10-2.41, 2.56-4.65 and 4.90 - 5.16 (All 15 H, m), 6.52 - 7.69 (7 H, m), 9.39 - 10.05(1 H, m).

{1722}

Working Example 844

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.13-4.01 and 4.48 - 4.72 {All 23 H, m, 2.33 (s) }, 5.10 (2 H, d, J=10.3H_Z), 6.43 - 7.64 (16 H, m).

{1723}

Working Example 845

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.09-4.20, 4.50-4.70 and 4.96 - 5.16 {All 23 H, m, 2.36 (s) }, 6.41 - 7.48 (12 H, m).

{1724}

実施例 849

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.2(4.5H, m), 2.7-3.0[全 5H,m,2.83(s)],3.1-3.3,3.3-3.5,3.6-3.85,4.35-4.5 及び 5.05-5.35[全 12.5H,m,3.40(t, J=7.4Hz), 3.67(s), 3.77(s)],6.62(1H,d,J=8.1Hz), 6.82(1H,d,J=8.1Hz), 6.9-7.4(4H,m)。

【1725】

実施例 850

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.95(6H,d,J=6.2Hz), 1.25-2.15,2.7-3.3,3.67,3.72,4.35-4.65 及び 5.10-5.4[全 19H,m,3.67(s), 3.72(s)],6.26,6.64,6.73-6.78,6.96 及び 7.12-7.4[全 6H,m,6.26(d,J=8.1Hz), 6.64(d,J=8.1Hz), 6.96(dd,J=8.1Hz,2.2Hz)]。

【1726】

実施例 851

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.2,2.7-3.0,3.15-3.3,3.4-4.0,4.4-4.55,4.6-4.8 及び 5.05-5.25 [全 20H,m,3.69(s), 3.71(s)],6.60-7.45[全 6H,m, 6.63(d,J=8.1Hz), 6.85(d,J=8.1Hz)]。

【1727】

実施例 852

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-2.30(4H, m), 2.57-3.03,3.09-3.33,3.43-3.92,4.38-4.63 及び 5.08-5.28[全 10H,m,3.62(s), 3.70(s)],6.53-7.43(10H,m)。

【1728】

実施例 853

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.30(4H, m), 2.60-3.05,3.10-3.37,3.46-4.33,4.38-4.62 及び 5.08-5.29[全 10H,m,3.67(s), 3.71(s), 3.81(s)],6.52-7.46(10H,m)。

Working Example 849

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :1.2- 2.2 (4.5 H, m), 2.7 - 3.0 {All 5 H, m, 2.83 (s) }, 3.1 - 3.33.3 - 3.53.6 - 3.85and 4.35 - 4.5 and 5.05 - 5.35 {All 12.5 H, m, 3.40 (t, J=7.4H_Z), 3.67 (s), 3.77 (s) }, 6.62 (1 H, d, J=8.1H_Z), 6.82 (1 H, d, J=8.1H_Z), 6.9 - 7.4 (4 H, m).

{1725}

Working Example 850

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :0.95 (6 H, d, J=6.2H_Z), 1.25 - 2.152.7 - 3.3 and 3.67 and 3.72and 4.35 - 4.65 and 5.10 - 5.4 {All 19 H, m, 3.67 (s), 3.72 (s) }, 6.26 and 6.64 and 6.73 - 6.78 and 6.96 and 7.12 - 7.4 {All 6 H, m, 6.26 (d, J=8.1H_Z), 6.64 (d, J=8.1H_Z), 6.96 (dd, J=8.1H_Z), 2.2H_Z }.

{1726}

Working Example 851

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :1.2- 2.2, 2.7-3.05, 3.15-3.3, 3.4- 4.0, 4.4- 4.55, 4.6-4.8 and 5.05 - 5.25 {All 20 H, m, 3.69 (s), 3.71 (s) }, 6.60 - 7.45 {All 6 H, m, 6.63 (d, J=8.1H_Z), 6.85 (d, J=8.1H_Z) }.

{1727}

Working Example 852

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :1.17-2.30 (4 H, m), 2.57 - 3.03 and 3.09 - 3.33 and 3.43 -3.92 and 4.38 - 4.63 and 5.08 - 5.28 {All 10 H, m, 3.62 (s), 3.70 (s) }, 6.53 - 7.43 (10 H, m).

{1728}

Working Example 853

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :1.18-2.30 (4 H, m), 2.60 - 3.05 and 3.10 - 3.37 and 3.46 -4.33 and 4.38 - 4.62 and 5.08 - 5.29 {All 10 H, m, 3.67 (s), 3.71 (s), 3.81 (s) }, 6.52 - 7.46 (10 H, m).

【1729】

実施例 854

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.19-2.46[7H, m,2.37(s)],2.58-3.04,3.05-4.26,4.38-4.63 及び 5.06-5.28[全 11H,m,3.67(s), 3.71(s)],6.54-7.48(10 H,m)。

【1730】

実施例 855

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.28(4H, m), 2.39(3H,s), 2.57-3.10,3.11-4.35,4.40-4.63 及び 5.08-5.30[全 8H,m,3.75(s)],6.47-6.71 及び 6.81-7.78(全 11H,m)。

【1731】

実施例 856

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.12-2.19(4 H,m), 2.57-4.08,4.20-4.66 及び 4.81-5.08[全 11 H,m,3.52(s), 3.65(s)],6.62-7.62(10H,m), 12.36 (1H,s)。

【1732】

実施例 857

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.10-2.19(4 H,m), 2.43-4.14,4.20-4.71 及び 4.83-5.10[全 11 H,m,3.59(s), 3.75(s)],6.67-7.65(10H,m), 12.20-12.57(1H,brs)。

【1733】

実施例 858

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.13-2.38 [7H,m,2.31(s)],2.51-4.02,4.19-4.75 及び 4.82-5.08[全 8H,m,3.59(s)],6.62-7.80(10H,m), 12.20-12.58(1H,brs)。

【1734】

実施例 859

の化合物

(10 H, m)。

{1729}

Working Example 854

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);δ ppm :1.19-2.46 {7 H, m, 2.37 (s) }, 2.58 - 3. 04 and 3. 05 - 4. 26 and 4. 38 -4.63 and 5.06 - 5.28 {All 11 H, m, 3.67 (s) , 3.71 (s) }, 6.54 - 7.48 (10 H, m).

{1730}

Working Example 855

compound

¹H-nmr (200 MH_Z), CDCl₃);δ ppm :1.20-2.28 (4 H, m), 2.39 (3 H, s), 2.57 - 3. 10 and 3. 11 - 4. 35 and4. 40 - 4.63 and 5.08 - 5.30 {All 8 H, m, 3.75 (s) }, 6.47 - 6.71 and 6.81 - 7.78 (All 11 H, m).

{1731}

Working Example 856

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);δ ppm :1.12-2.19 (4 H, m), 2.57 - 4. 08 and 4. 20 - 4.66 and 4.81 - 5.08{All 11 H, m, 3.52 (s) , 3.65 (s) }, 6.62 - 7.62 (10 H, m), 12.36 (1 H, s).

{1732}

Working Example 857

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);δ ppm :1.10-2.19 (4 H, m), 2.43 - 4. 14 and 4. 20 - 4.71 and 4.83 - 5.10{All 11 H, m, 3.59 (s) , 3.75 (s) }, 6.67 - 7.65 (10 H, m), 12.20 - 12.57 (1 H, brs).

{1733}

Working Example 858

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);δ ppm :1.13-2.38 {7 H, m, 2.31 (s) }, 2.51 - 4. 02 and 4. 19 - 4.75 and 4.82 - 5.08{All 8 H, m, 3.59 (s) }, 6.62 - 7.80 (10 H, m), 12.20 - 12.58 (1 H, brs).

{1734}

Working Example 859

compound

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.18-2.18(4 H,m), 2.34(3H,s), 2.48-4.12,4.20-4.80 及び 4.89-5.12(全 5H,m), 6.61-7.88(11H,m), 12.12-12.60 (1H,m)。

【1735】

実施例 860

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.25,2.50-3.03,3.10-3.30,3.48-3.91,4.25-4.55 及び 5.05-5.28[全 19H,m,3.71(s), 3.74(s), 4.40(t,J=5.9Hz)],6.42-7.42 及び 7.71-7.99[全 7H,m,6.58(d,J=8.3Hz), 7.86(d,J=8.3Hz)]。

【1736】

実施例 861

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.75-2.21,2.51-3.31,3.45-4.10,4.30-4.60 及び 5.03-5.31[全 24H,m,0.95(d,J=6.7Hz), 3.92(d,J=7.2Hz), 3.72(s), 3.74(s)],6.42-7.41 及び 7.65-8.00[全 7H,m,6.58(d,J=8.3Hz), 7.88(d,J=8.3Hz)]。

【1737】

実施例 862

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-2.31,2.51-3.32,3.42-4.09,4.30-4.58 及び 5.05-5.21[全 19H,m,3.79(s), 4.44(t,J=7.8Hz)],6.49-7.42[6H,m,6.62(d,J=8.3Hz)]。

【1738】

実施例 863

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.88(6H,d,J=6.7Hz)1.10-2.07,2.52-4.45 及び 4.85-5.02[全 15 H,m,3.63(s), 3.98(d,J=7.2Hz)],6.50-6.88,6.98-7.29,7.38-7.79 及び 8.28-8.49[全 7H,m,6.70(d,J=8.3Hz), 7.52(d,J=8.3Hz)]。

【1739】

実施例 864

の化合物

¹H-nmr (200 MHz_Z), DMSO -d₆);de ppm :1.18-2.18 (4 H, m), 2.34 (3 H, s), 2.48 - 4. 12 and 4. 20 - 4.80 and4.89 - 5.12 (All 5 H, m), 6.61 - 7.88 (11 H, m), 12.12 - 12.60 (1 H, m).

{1735}

Working Example 860

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃);de ppm :1.15-2.25, 2.50-3.03, 3.10-3.30, 3.48-3.91, 4.25-4.55 and 5.05 - 5.28 {All 19 H, m, 3.71 (s), 3.74 (s), 4.40 (t, J=5.9H_Z) }, 6.42 - 7.42 and 7.71 - 7.99 {All 7 H, m, 6.58 (d, J=8.3H_Z), 7.86 (d, J=8.3H_Z) }.

{1736}

Working Example 861

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃);de ppm :0.75-2.21, 2.51-3.31 , 3.45-4.10, 4.30-4.60 and 5.03 - 5.31 {All 24 H, m, 0.95 (d, J=6.7H_Z), 3.92 (d, J=7.2H_Z), 3.72 (s), 3.74 (s) }, 6.42 - 7.41 and 7.65 - 8.00 {All 7 H, m, 6.58 (d, J=8.3H_Z), 7.88 (d, J=8.3H_Z) }.

{1737}

Working Example 862

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃);de ppm :1.11-2.31 , 2.51-3.32, 3.42-4.09, 4.30-4.58 and 5.05 - 5.21 {All 19 H, m, 3.79 (s), 4.44 (t, J=7.8H_Z) }, 6.49 - 7.42 {6 H, m, 6.62 (d, J=8.3H_Z) }.

{1738}

Working Example 863

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), DMSO -d₆);de ppm :0.88 (6 H, d, J=6.7H_Z) 1.10 - 2. 07 and 2. 52 - 4.45 and 4.85 - 5.02{All 15 H, m, 3.63 (s), 3.98 (d, J=7.2H_Z) }, 6.50 - 6. 88 and 6. 98 - 7. 29 and 7. 38 - 7.79 and 8.28 -8.49 {All 7 H, m, 6.70 (d, J=8.3H_Z), 7.52 (d, J=8.3H_Z) }.

{1739}

Working Example 864

compound

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.01-2.10, 2.39-4.51 及び 4.86-5.05[全 13H,m,3.67(s)],6.0-7.75(6H,m), 9.99(1H,s)。

【1740】

実施例 865

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-2.21,2.60-3.29,3.41-3.90,4.41-4.65 及び 4.82-5.20[全 19H, m,1.26(d,J=6.4Hz), 3.69(s)],6.53-7.80[全 8H,m, 6.71(s), 7.46(s)]。

【1741】

実施例 866

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.85-2.18,2.45-3.90,4.29-4.60 及び 4.78-5.18[全 16H,m,1.28(d,J=7.2Hz)],6.40-7.81(8H,m), 7.90-9.60(1H,m)。

【1742】

実施例 867

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-2.29,2.68-3.92,4.38-4.70 及び 5.01-5.19[全 20H,m,1.50(s), 1.58(s), 2.16(s), 3.70(s)],6.78-7.90[全 7H,m,7.59(d,J=2.1Hz)]。

【1743】

実施例 868

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.06-2.69,2.98-4.26 及び 4.60-4.81[全 33H,m,2.32(s), 2.39(s)], 6.42-7.45(7H,m)。

【1744】

実施例 869

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.68-2.72,3.01-4.25 及び 4.65-4.92[全 25H,m,2.32(s), 2.47(s), 3.82(s)],6.46-7.12(11H,m)。

【1745】

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);de ppm :1.01-2.10, 2.39-4.51 and 4.86 - 5.05 {All 13 H, m, 3.67 (s) }, 6.0 - 7.75 (6 H, m), 9.99 (1 H, s) .

{1740}

Working Example 865

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.11-2.21, 2.60-3.29, 3.41-3.90, 4.41-4.65 and 4.82 - 5.20 {All 19 H, m, 1.26 (d, J=6.4H_Z), 3.69 (s) }, 6.53 - 7.80 {All 8 H, m, 6.71 (s), 7.46 (s) } .

{1741}

Working Example 866

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :0.85-2.18, 2.45-3.90, 4.29-4.60 and 4.78 - 5.18 {All 16 H, m, 1.28 (d, J=7.2H_Z), 6.40 - 7.81 (8 H, m), 7.90 - 9.60 (1 H, m) .

{1742}

Working Example 867

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.11-2.29, 2.68-3.92, 4.38-4.70 and 5.01 - 5.19 {All 20 H, m, 1.50 (s), 1.58 (s), 2.16 (s), 3.70 (s) }, 6.78 - 7.90 {All 7 H, m, 7.59 (d, J=2.1H_Z) } .

{1743}

Working Example 868

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.06-2.69, 2.98-4.26 and 4.60 - 4.81 {All 33 H, m, 2.32 (s), 2.39 (s) }, 6.42 - 7.45 (7 H, m) .

{1744}

Working Example 869

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.68-2.72, 3.01-4.25 and 4.65 - 4.92 {All 25 H, m, 2.32 (s), 2.47 (s), 3.82 (s) }, 6.46 - 7.12 (11 H, m) .

{1745}

実施例 870

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.93-2.98,3.29-4.59 及び 4.69-5.31[全 23H,m,2.35(s), 3.60(t,J=5.5Hz), 4.35(t,J=5.3Hz), 6.69-7.70(7H,m)。]

【1746】

実施例 871

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.16-2.98,3.42-3.91,4.02-4.25,4.60-4.88 及び 5.02-5.40[全 19H,m,2.35(s), 4.79(s)],6.61-7.05 及び 7.13-7.94(全 12H,m)。

【1747】

(11H,m)。

【1748】

実施例 873

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.80-2.61,2.88-3.72,3.85-4.40 及び 4.62-5.01[全 27H,m,1.31(t,J=7.0Hz), 2.35(s), 4.22(q,J=7.1Hz)],6.41-7.49(7H,m)。

【1749】

実施例 874

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-1.48,1.68-2.62,2.95-4.41 及び 4.71-5.05[全 19H,m,1.31(t,J=7.1Hz), 2.50(s), 3.80(s), 4.22(q,J=6.8Hz)],6.45-7.65(全 11H,m)。

【1750】

実施例 875

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-2.62,2.90-3.70,3.85-4.21 及び 4.65-4.95[全 22H,m,2.35(s)],6.35-7.45(7H,m)]。

【1751】

実施例 876

の化合物

Working Example 870

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :1.93-2.98, 3.29-4.59 and 4.69 - 5.31 {All 23 H, m, 2.35 (s), 3.60 (t, J=5.5H), 4.35 (t, J=5.3H), 6.69 - 7.70 (7 H, m). }

{1746}

Working Example 871

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :2.16-2.98, 3.42-3.91, 4.02-4.25, 4.60-4.88 and 5.02 - 5.40 {All 19 H, m, 2.35 (s), 4.79 (s) }, 6.61 - 7.05 and 7.13 - 7.94 (All 12 H, m).

{1747}

(11 H, m).

{1748}

Working Example 873

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :0.80-2.61, 2.88-3.72, 3.85-4.40 and 4.62 - 5.01 {All 27 H, m, 1.31 (t, J=7.0H), 2.35 (s), 4.22 (q, J=7.1H), 6.41 - 7.49 (7 H, m).

{1749}

Working Example 874

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :1.18-1.48, 1.68-2.62, 2.95-4.41 and 4.71 - 5.05 {All 19 H, m, 1.31 (t, J=7.1H), 2.50 (s), 3.80 (s), 4.22 (q, J=6.8H), 6.45 - 7.65 (All 11 H, m).

{1750}

Working Example 875

compound

¹H-nmr (200 MHz,CDCl₃);de ppm :1.10-2.62, 2.90-3.70, 3.85-4.21 and 4.65 - 4.95 {All 22 H, m, 2.35 (s) }, 6.35 - 7.45 (7 H, m)).

{1751}

Working Example 876

compound

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.69-2.62,2.81-4.28 及び 4.65-4.98[全 14H,m,2.43(s), 3.80(s)], 6.41-7.62[11H,m,7.38(d,J=9.2Hz)]。

【1752】

実施例 877

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.53(9H,s), 1.71-2.24,2.50-2.91,3.49-4.45 及び 4.61-5.10[全 12H,m,3.59(t,J=6.3Hz), 4.28(t,J=6.0Hz)], 6.65-7.80 及び 8.55-8.68(全 8H,m)。

【1753】

実施例 878

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.53(9H,s), 2.09-2.31,2.52-2.82,3.55-4.51 及び 4.62-5.09[全 12H,m,2.17(t,J=5.1Hz), 4.37(t,J=5.5Hz)], 6.89-7.71(7H,m)。

【1754】

実施例 879

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.05-2.90 及び 3.46-5.10[全 12H,m,3.60(t,J=5.8Hz), 4.38(t,J=5.3Hz)], 6.81-7.71(7H,m), 10.1-10.6(1H,m)。

【1755】

実施例 880

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.51-2.88 及び 3.10-5.15[全 6H,m,4.94(s)], 6.70-7.35,7.45-7.85,7.92-8.28 及び 8.55-8.65(全 13H,m)。

【1756】

実施例 881

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-1.41,2.51-2.86,3.69-4.01,4.10-4.48 及び 4.62-4.98[全 13H,m,1.29(t,J=4.0Hz), 4.69(s)], 6.65-7.10 及び 7.19-7.92[全 12H,m,7.73(d,J=8.8Hz), 7.84(d,J=7.0H

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :1.69-2.62, 2.81-4.28 and 4.65 - 4.98 {All 14 H, m, 2.43 (s), 3.80 (s)}, 6.41 - 7.62 {11 H, m, 7.38 (d, J=9.2H_Z) }.

{1752}

Working Example 877

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :1.53 (9 H, s), 1.71 - 2.24 and 2.50 - 2.91 and 3.49 - 4.45 and 4.61 - 5.10 {All 12 H, m, 3.59 (t, J=6.3H_Z), 4.28 (t, J=6.0H_Z) }, 6.65 - 7.80 and 8.55 - 8.68 (All 8 H, m).

{1753}

Working Example 878

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :1.53 (9 H, s), 2.09 - 2.31 and 2.52 - 2.82 and 3.55 - 4.51 and 4.62 - 5.09 {All 12 H, m, 2.17 (t, J=5.1H_Z), 4.37 (t, J=5.5H_Z) }, 6.89 - 7.71 (7 H, m).

{1754}

Working Example 879

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :2.05-2.90 and 3.46 - 5.10 {All 12 H, m, 3.60 (t, J=5.8H_Z), 4.38 (t, J=5.3H_Z) }, 6.81 - 7.71 (7 H, m), 10.1 - 10.6 (1 H, m).

{1755}

Working Example 880

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z, DMSO -d₆); de ppm :2.51-2.88 and 3.10 - 5.15 {All 6 H, m, 4.94 (s)}, 6.70 - 7.35 and 7.45 - 7.85 and 7.92 - 8.28 and 8.55 - 8.65 (All 13 H, m).

{1756}

Working Example 881

compound

¹H-nmr (200 MHz_Z), CDCl₃; de ppm :1.12-1.41, 2.51-2.86, 3.69-4.01, 4.10-4.48 and 4.62 - 4.98 {All 13 H, m, 1.29 (t, J=4.0H_Z), 4.69 (s)}, 6.65 - 7.10 and 7.19 -

z)】。

【1757】

実施例 882

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:2.30-2.76, 3.56-3.96 及び 4.27-4.80(全 4H,m), 4.94(2H,s), 6.71-7.90(8H,m)。

【1758】

実施例 883

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.60-2.09,2.28-4.32 及び 4.60-5.10(全 10H,m), 6.41-8.25 及び 8.41-8.90[全 13H,m,8.12(d,J=7.4Hz)]。

【1759】

実施例 884

の化合物

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-1.49 及び 2.25-4.99[全 15H,m,1.31(t,J=7.1Hz)],6.60-7.90 及び 8.00-8.28[全 12H,m,8.12(d,J=7.7Hz)]。

【1760】

実施例 885

の化合物

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.85-4.70 及び 4.88-6.20(全 11H,m), 6.51-8.62[全 12H,m, 7.94(d,J=7.2Hz)]。

【1761】

試験 1)V₁リセプター バインディング アッセイ(V₁receptor binding assay)

イチハラ(Akira Ichihara)の方法[J.Bio.Chem.,25 8,9283(1983)]に準じて調製したラット肝臓の膜標本を用いて、[³H]-Arg-バソプレシン(vasopressin)の 50000dpm(2×10⁻¹⁰M)膜標本 60 μg 試験薬(10⁻⁸~10⁻⁴M)を、5mM MgCl₂、1mM EDTA 及び 0.1% BSA を含む 100mM トリスー塩酸緩衝液(pH=8.0)の総量 250 μl 中で 10 分間、37 deg C でインキュベーションした。

7.92 {All 12 H, m, 7.73 (d, J=8.8H_Z), 7.84 (d, J=7.0H_Z)}。

{1757}

Working Example 882

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);de ppm :2.30-2.76, 3.56-3.96 and 4.27 - 4.80 (All 4 H, m), 4.94 (2 H, s), 6.71 - 7.90 (8 H, m) .

{1758}

Working Example 883

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.60-2.09, 2.28-4.32 and 4.60 - 5.10 (All 10 H, m), 6.41 - 8.25 and 8.41 - 8.90 {All 13 H, m, 8.12 (d, J=7.4H_Z)} .

{1759}

Working Example 884

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, CDCl₃);de ppm :1.05-1.49 and 2.25 - 4.99 {All 15 H, m, 1.31 (t, J=7.1H_Z)} , 6.60 - 7.90 and 8.00 - 8.28 {All 12 H, m, 8.12 (d, J=7.7H_Z)} .

{1760}

Working Example 885

compound

¹H-nmr (200 MH_Z, DMSO -d₆);de ppm :0.85-4.70 and 4.88 - 6.20 (All 11 H, m), 6.51 - 8.62 {All 12 H, m, 7.94 (d, J=7.2H_Z)} .

{1761}

<pharmacological test example >

Test 1) V₁receptor binding assay (V₁receptorbinding assay)

{³H } -Arg-vasopressin 50000 dpm (2 X 10⁻¹⁰M) film preparation 60;mu g test medicine (10⁻⁸~10⁻⁴M) of (vasopressin), 5 mM MgCl₂, 1mM EDTA and in total weight 250;mu l of 100 mM [torisuu] hydrochloric acid buffer (pH =8.0) which include 0.1%BSA incubation were done with 10 min , 37deg C making use of film preparation of the rat liver which is manufactured according to method {J.Bio.Chem ., 258, 9283 (1983) } of [ichihara] (Akiralchihara) .

その後、ガラスフィルター(GF/F)を用いて、バソプレシンと結合した膜標本を分離するために濾過を3回行ない緩衝液5mlにて洗浄した。

このガラスフィルターを取り出し、液体シンチレーション用カクテルと混合し、液体シンチレーションカウンターにて膜と結合した $[^3\text{H}]$ -バソプレシン量を測定し、阻害率を次式により算出した。

【1762】

$$\text{阻害率(\%)} = 100 - [(C_1 - B_1) / (C_0 - B_1)] \times 100$$

C_1 : 既知量の供試薬剤と $[^3\text{H}]$ -バソプレシンとの共存下での $[^3\text{H}]$ -バソプレシンの膜に対する結合量

C_0 : 供試薬剤を除いた時の $[^3\text{H}]$ -バソプレシンの膜に対する結合量

B_1 : 過剰のバソプレシン(10^{-6}M)存在下での $[^3\text{H}]$ -バソプレシンの膜に対する結合量

上記で算出された阻害率が50%となる供試薬剤の濃度を求め、これを IC_{50} 値とした。

結果を下記表に示す。

【1763】

試験2) V_2 リセプター バインディング アッセイ(V_2 receptor binding assay)

O. HECHTER の方法[J. Bio. Chem., 253, 3211 (1978)]に準じて調製したラット腎臓の膜標本を用いて、 $[^3\text{H}]$ -Arg-バソプレシン(vasopressin)の100000dpm($4 \times 10^{-10}\text{M}$)膜標本0.6mg 試験薬($10^{-10} \sim 10^{-5}\text{M}$)を、5mM MgCl_2 、1mM EDTA 及び0.1%BSAを含む100mM トリス-塩酸緩衝液(pH=8.0)の総量250 μl 中で3時間、4 deg Cでインキュベーションした。

その後、ガラスフィルター(GF/F)を用いて、バソプレシンと結合した膜標本を分離するために濾過を行ない2回緩衝液5mlにて洗浄した。

このガラスフィルターを取出し、液体シンチレーション用カクテルと混合し、液体シンチレーションカウンターにて膜と結合した $[^3\text{H}]$ -バソプレシン量を測定し、阻害率を次式により算出した。

【1764】

$$\text{阻害率(\%)} = 100 - [(C_1 - B_1) / (C_0 - B_1)] \times 100$$

After that, in order to separate film preparation which is connected with the vasopressin making use of glass filter (GF/F), filtration was washed with thrice doing buffer 5ml.

It removed this glass filter, mixed with cocktail for liquid scintillation, connected with film with liquid scintillation counter $\{^{3\text{H}}\}$ -vasopressin to measure quantity, the inhibition ratio was calculated with next formula.

{1762}

$$\text{inhibition ratio (\%)} = 100 - \{ (C_{\text{sub}1} - B_{\text{sub}1}) / (C_{\text{sub}0} - B_{\text{sub}1}) \} \times 100$$

test chemical of $C_{\text{sub}1}$; known amount and $\{^{3\text{H}}\}$ bound amount -vasopressin for $\{^3\text{H}\}$ -vasopressin film under coexisting

When excluding $C_{\text{sub}0}$; test chemical, $\{^{3\text{H}}\}$ bound amount -vasopressin for film

bound amount for $\{^{3\text{H}}\}$ -vasopressin film under vasopressin (10^{-6}M) existing of the $B_{\text{sub}1}$; excess

concentration of test chemical where inhibition ratio which was calculated at description above becomes 50% was sought, this was designated as IC_{50} value.

Result is shown in below-mentioned chart.

{1763}

Test 2) $\text{V}_{\text{sub}2}$ receptor binding assay ($\text{V}_{\text{sub}2}$ receptor binding assay)

$\{^3\text{H}\}$ -Arg-vasopressin 100000 dpm ($4 \times 10^{-10}\text{M}$) film preparation 0.6mg test medicine ($10^{-10} \sim 10^{-5}\text{M}$) of (vasopressin), 5 mM $\text{MgCl}_{\text{sub}2}$, 1mM EDTA and in total weight 250 μl of 100 mM tris -hydrochloric acid buffer (pH=8.0) which include 0.1% BSA incubation were done with 3 hours, 4 deg C making use of film preparation of rat kidney which is manufactured according to method {J. Bio. Chem., 253, 3211 (1978)} of O. HECHTER.

After that, it filtered in order to separate film preparation which is connected with vasopressin making use of glass filter (GF/F), and washed with twice buffer 5ml.

It removed this glass filter, mixed with cocktail for liquid scintillation, connected with film with liquid scintillation counter $\{^{3\text{H}}\}$ -vasopressin to measure quantity, the inhibition ratio was calculated with next formula.

{1764}

$$\text{inhibition ratio (\%)} = 100 - \{ (C_{\text{sub}1} - B_{\text{sub}1}) / (C_{\text{sub}0} - B_{\text{sub}1}) \} \times 100$$

C₁:既知量の供試薬剤と[³H]-バゾプレシンの共存下での[³H]-バゾプレシンの膜に対する結合量

C₀:供試薬剤を除いた時の[³H]-バゾプレシンの膜に対する結合量

B₁:過剰のバゾプレシン(10⁻⁶M)存在下での[³H]-バゾプレシンの膜に対する結合量

上記で算出された阻害率が 50%となる供試薬剤の濃度を求め、これを IC₅₀ 値とした。

結果を下記表に示す。

【1765】

【表 492】

供試化合物	V ₁ (IC ₅₀ μM)	V ₂ (IC ₅₀ μM)
実施例 29 の化合物	0.021	0.15

【1766】

試験 3) in vivo における抗バゾプレッサー作用

覚醒下で供試化合物の経口投与による抗バゾプレッサー作用を調べるために、ペントバルビタール麻酔下に SD 系雄性ラット(体重 300~450g)の腹部大動脈及び頸動脈にカニユーレを挿入した。

手術後 2~3 日の回復期の後、血圧は腹部大動脈のカニユーレより圧トランスデューサを用い、覚醒下に測定し、バゾプレシンは頸動脈より投与した。

供試化合物は、ポリエチレングリコール 400 や水に溶解もしくは 5%アラビアゴム溶液に懸濁させた状態で経口投与した。

【1767】

供試化合物投与前のバゾプレシン 30mU/kg 静脈内投与による拡張期血圧の上昇を 100%とし、供試化合物投与後は 30 分間隔で投与後 8 時間まで、バゾプレシン 30mU/kg 静脈内投与による拡張期血圧の上昇を測定し、供試化合物による血圧上昇の抑制率をもって供試化合物の抗バゾプレッサー作用とした。

(C₀-B₁) X 100

test chemical of C₁;known amount and {³H} bound amount -vasopressin for {³H} -vasopressin film under coexisting

When excluding C₀;test chemical , {³H} bound amount -vasopressin for film

bound amount for {³H} -vasopressin film under vasopressin (10⁻⁶M) existing of the B₁;excess

concentration of test chemical where inhibition ratio which was calculated atdescription above becomes 50% was sought, this was designated as IC₅₀ value.

Result is shown in below-mentioned chart.

{1765}

{Table 49 2 }

{1766}

Test 3) Anti- [bazopuressaa] action in invivo

In order under arousal to inspect anti- [bazopuressaa] action with oral dosage of test compound , cannula was inserted in abdominal aorta and carotid artery of the SD male rat (body weight 300~450g) under pentobarbital anesthetic .

After recovery phase of 2 - 3 days after surgery , it measured blood pressure under arousal making use of pressure transducer from cannula of the abdominal aorta , prescribed [bazopureshin] from carotid artery .

test compound in polyethylene glycol 400 and water in melting or 5% gum arabic solution oral dosage did with state which suspension is done.

{1767}

It rose diastolic blood pressure [bazopureshin] with 30 mU /kg intravenous administration before test compound prescribing, 100%after test compound dosage with 30 minute spacing after prescribing up to 8 -hour , [bazopureshin] it measured rise of diastolic blood pressure with 30 mU /kg intravenous administration , it made anti- [bazopuressaa]action of test compound with test compound with suppression rate of blood pressure rise

【1768】

効果用量 ID₅₀ 値は、バゾプレシン 30mU/kg 静脈内投与による拡張期血圧の上昇を 50%抑制する時の、供試化合物の経口投与量として求めた。

【1769】

実施例 29

及び実施例 70 の化合物は、それぞれ 1.0mg/kg、2.8mg/kg の ED₅₀ 値を示した。

【1770】

試験 4) 抗-抗利尿作用(内因性 ADH に対する作用)

無処置、無拘束下のラット(SD 系、雄、体重 300~350g)に、供試化合物及び溶媒(ジメチルホルムアミド)を経口投与し、2 時間の間に自発的に排出された尿を代謝ゲージにて集めた。

この間、水及び餌は自由に摂取させた。

【1771】

実施例 493

の化合物を 10mg/kg 経口投与することにより、投与直後から 2 時間までの尿量は、溶媒投与群に比して、4 倍に増加した。

【1772】

試験 5) 抗利尿作用

無処置、無拘束下の遺伝的にバゾプレシンが欠如したラット(Brattleboro ラット)に、供試化合物をポリエチレングリコール 400 や水に溶解もしくは 5%アラビアゴム溶液に懸濁させた状態で強制的に経口投与した。

投与後代謝ゲージにて、自発的に排出された尿を 2 時間間隔にて採取した。

この間、水及び餌は自由に摂取させた。

【1773】

実施例 562

の化合物を 1mg/kg 経口投与することにより、投与直後から 2 時間までの尿量は、溶媒投与群に比して、1/5 に減少した。

【0002】

with suppression rate of blood pressure rise .

{1768}

When [bazopureshin] rise of diastolic blood pressure 50% controlling with 30 mU /kg intravenous administration , it sought effective dose ID₅₀ value, as oral dosage of test compound .

{1769}

Working Example 29

And compound of Working Example 70 showed ED₅₀ value of 1.0 mg/kg , 2.8mg/kg respectively.

{1770}

Test 4) Resistance - anti- diuretic action (Action for endogenic ADH)

In rat (SD system, male , body weight 300~350g) under untreated , non restraint , test compound and solvent (dimethylformamide) oral dosage were done, urine which between 2 hours is discharged in spontaneous was gathered with metabolism gauge .

At this time, uptake it did water and bait freely.

{1771}

Working Example 493

From immediately after prescribing urine quantity to 2 hours , comparing to solvent treated group , increased in 4 -fold by 10 mg/kg oral dosage doing the compound .

{1772}

Test 5) Anti- diuretic action

In rat (Brattleboro rat) where [bazopureshin] lacks in genetic under untreated , non restraint , test compound in polyethylene glycol 400 and water in melting or 5% gum arabic solution the oral dosage was done forcedly with state which suspension is done.

After prescribing with metabolism gauge , urine which is discharged in the spontaneous it recovered with 2 hours spacing .

At this time, uptake it did water and bait freely.

{1773}

Working Example 562

From immediately after prescribing comparing to solvent treated group , it decreased urine quantity to 2 hours , to 1/5 by 1 mg/kg oral dosage doing the compound .

{0002}

【発明が解決しようとする課題】

本発明は、バソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤、バソプレシン作動剤等として有用な医薬組成物を提供することを課題とする。

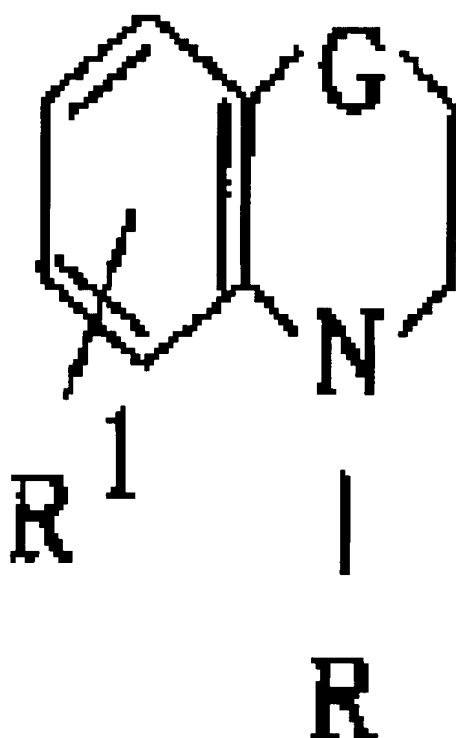
【0003】

【課題を解決するための手段】

本発明の医薬組成物中に含有されるベンゾヘテロ環誘導体は、下記一般式(1)で表わされる。

【0004】

【化 19】



(1)

【0005】

【式中 G は】

【0006】

【化 20】

[Problems to be Solved by the Invention]

this invention designates that useful pharmaceutical composition is offered as vasopressin antagonist, oxytocin antagonist, vasopressin operation agent etc as problem.

【0003】

[Means to Solve the Problems]

benzo heterocyclic derivative which is contained in pharmaceutical composition of this invention is displayed with below-mentioned General Formula (1).

【0004】

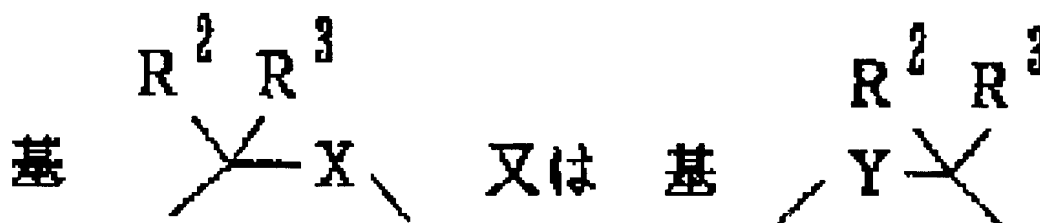
[Chemical Formula 19]

【0005】

{As for G in Formula }

【0006】

[Chemical Formula 20]



【0007】

を示す。

R¹ は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。

R² は、基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は、同一又は異なつて、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。); 水素原子; 水酸基; 低級アルコキシ基; カルボキシ置換低級アルキル基; シアノ置換低級アルキル基; テトラゾリル基置換低級アルキル基; 低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基; 低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基; 置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基; 低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基; カルボキシ置換低級アルコキシ基; 低級アルカノイル基; 又は基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m 及び u はそれぞれ 0 又は 1 を示す。但し m 及び u は同時に 0 であつてはならない。A は低級アルキレン基を示す。R⁶ 及び R⁷ は同一又は異なつて、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R⁶ 及び R⁷ は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく 5~7 員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換してい

【0007】

It shows.

R¹ shows amino carbonyl lower alkoxy group which has fact that it possesses the lower alkyl group as amino group, carboxy substitution lower alkoxy group, lower alkoxy carbonyl substitution lower alkoxy group or substituent which has times when it possesses lower alkyl group as amino lower alkoxy group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and lower alkanoyl group as hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, substituent.

R² amino substitution lower alkanoyl oxy group; lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group; carboxyl substitution lower alkoxy group; lower alkanoyl group; or basis which has times when it possesses lower alkyl group basis -NR⁴R⁵ (R⁴ and R⁵ show benzoyl group which has fact that it possesses halogen atom as substituent on lower alkyl group or phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group as alike or different, hydrogen atom, substituent.); as hydrogen atom; hydroxy group; lower alkoxy group; carboxy substituted lower alkyl group; cyano substituted lower alkyl group; tetrazolyl group substituted lower alkyl group; lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group; lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group; substituent - shows (O) m-A-(CO) uNR⁶R⁷ (m and u show 0 or 1 respectively. However m or u with 0 do not become simultaneous. A shows lower alkylene group.

R⁶ and R⁷ show phenyl group which has fact that it possesses halogen atom on amino substituted lower alkyl group, carbamoyl group substituted lower alkyl group, adamantyl group substituted lower alkyl group, lower alkyl sulfonyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as alike or different, hydrogen atom, lower alkoxy group, lower alkyl group, substituent. R⁶ and R⁷ with nitrogen atom which these connect through the nitrogen atom or oxygen atom or 5 - 7 - member ring may form saturated heterocycle without minding. On said heterocycle,

てもよい。)を示す。

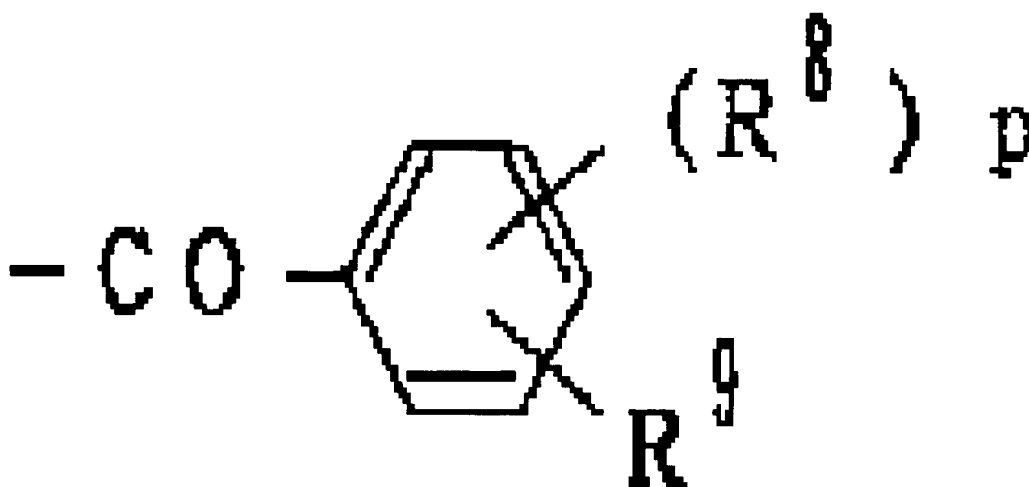
R³ は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。

また R² と R³ とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。

R は、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基;シクロアルキルカルボニル基又は基

【0008】

【化 21】



【0009】

(p は 1 又は 2 を示す。R⁸ は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R⁹ は、基-NR¹⁰R¹¹(R¹⁰ は水素原子、低級アルキル基又

group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and phenyl lower alkyl group optionally substitutable .).

R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group .

In addition R² and R³, these becoming simultaneous, the oxo group , lower alkylidene group , lower alkoxy-substituted lower alkylidene group , lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group , or it is possible to form phenyl substitution lower alkylidene group .

As for R, On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl-group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Which have times when it possesses phenyl group as substituent thegroup which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has times when itpossesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has timeswhen it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent thiazolyl carbonyl group ;cycloalkyl carbonyl group or basis

【0008】

[Chemical Formula 21]

【0009】

p shows 1 or 2 . R⁸ shows amino group , nitro group , halogen atom or lower alkoxy group which has times when itpossesses lower alkanoyl group as hydrogen atom , lower alkyl group , hydroxy group , substituent . As for R⁹, basis -NR¹⁰R¹¹

は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R¹¹は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基))

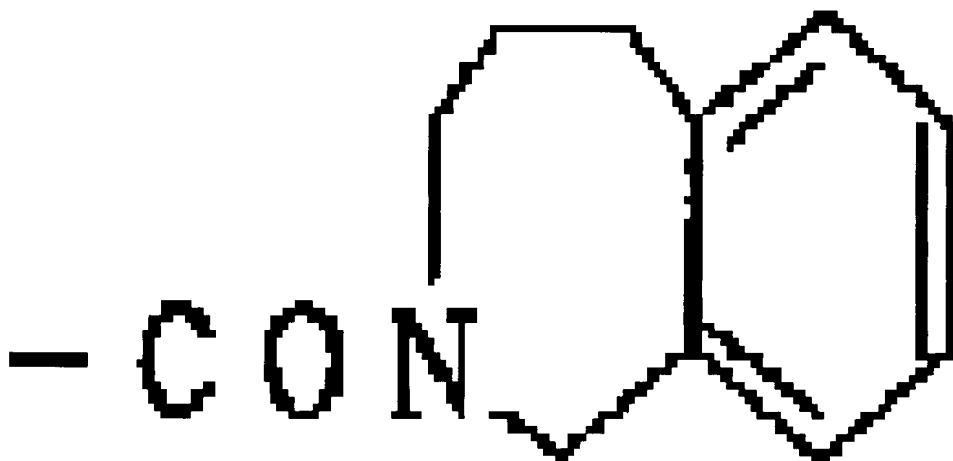
【0010】

【化 22】

(R¹⁰ shows lower alkanoyl group which has fact that it possesses the halogen atom hydrogen atom, lower alkyl group or as substituent. As for R¹¹ from group which becomes halogen atom and hydroxy group as lower alkyl group, substituent on lower alkanoyl group, cycloalkyl group, phenyl ring which has times when it possesses the group which is chosen there are times when it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and halogen atom as substituent, and On phenyl lower alkyl group, phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group in the lower alkyl group portion on phenoxy lower alkyl group, phenyl ring which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent as substituent there are times when it possesses group which is chosen from group which becomes amino group, nitro group, lower alkanoyl group substituted amino group and halogen atom which have times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group, phenyl group, lower alkoxy group, halogen atom substituted lower alkyl group, substituent, and In lower alkanoyl group portion lower alkoxy carbonyl group, lower alkoxy-substituted lower alkanoyl group, lower alkanoyl oxy substitution lower alkanoyl group, phenoxy lower alkoxy carbonyl group, benzo furil carbonyl group, benzoimidazolyl carbonyl group; quinolyl carbonyl group, quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, phenyl lower alkoxy carbonyl group, basis which has times when it possesses halogen atom as amino carbonyl group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group, pyridyl lower alkyl group and phenyl lower alkyl group as phenoxy lower alkanoyl group, substituent which has fact that it possesses halogen atom as substituent)

【0010】

[Chemical Formula 22]



【0011】

、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。

また R^{10} 及び R^{11} は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。

);

水素原子;

低級アルカノイルオキシ基;

低級アルカノイル基;

低級アルコキシ基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基;

シクロアルキル基;

低級アルキル基;

低級アルキルチオ基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を

【0011】

On tetrahydroisoquinolyl carbonyl group, benzoyl lower alkyl group, quinoline ring from group which becomes lower alkyl group and oxo group as substituent on tetrahydroquinolyloxy substitution lower alkanoyl group, lower alkyl sulfonyl group, pyridyl lower alkoxy carbonyl group, fluorenyl lower alkoxy carbonyl group, lower alkenyl oxycarbonyl group, tetrahydro naphthyloxy substitution lower alkanoyl group, phenyl lower alkenyl carbonyl group, piperidine ring which has times when it possesses group which is chosen bipyridinyl lower alkoxy carbonyl group which has fact that it possesses group which is chosen is shown from group which becomes lower alkanoyl group, lower alkoxy carbonyl group and lower alkyl group as substituent.

In addition R^{10} and R^{11} with nitrogen atom which these connect may form isoindoline ring.

);

hydrogen atom;

lower alkanoyl oxy group;

lower alkanoyl group;

lower alkoxy group;

On phenyl ring benzoyl group; which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

cycloalkyl group;

lower alkyl group;

lower alkyl thio group;

On phenyl ring phenyl lower alkanoyl group; which has

有することのあるフェニル低級アルカノイル基;

フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基;フェノキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基;ピロリジニル置換低級アルコキシ基;窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1-4 個有する飽和もしくは不飽和の 5-11 員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を 1-3 個有していてもよい);シクロアルケニル基;フェニル低級アルキルアミノカルボニル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基;シアノ基;又は基-(A)m-CHR¹²R¹³(A は前記に同じ。R¹² は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。m は 0 又は 1 を示す。)を示す。

)。

X はメチレン基、単結合、基=CH-又は基-NR¹⁴- (R¹⁴ は水素原子、低級アルキル基又は低級ア

times when it possesses lower alkyl group as substituent

On phenyl ring as substituent amino group, phenyl group which has times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group, lower alkoxy group, phenyl lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, halogen atom substitution lower alkoxy group, nitro group, substituent and From group which becomes amino substitution lower alkoxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group; phenoxy group; phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on phenoxy lower alkyl group; phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on the phenyl lower alkyl group; phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent the times when it possesses lower alkyl group as substituent it is On anilino lower alkyl group; phenyl ring as halogen atom, lower alkoxy carbonyl group and substituent as substituent lower alkyl group and From group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent from group which becomes the amino carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen on phenyl lower alkoxy group; phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on benzoyl lower alkoxy group; phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent on phenyl lower alkenyl group; phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent as substituent lower alkyl group it possesses amino sulfonyloxy group; cyano group; or basis which has times when it possesses lower alkyl group monocycle of 5 - 11 member rings of saturated or unsaturated which 1 - 4 possesses benzoyl lower alkyl group; pyrrolidinyl substitution lower alkoxy group; nitrogen atom, oxygen atom or sulfur atom which has thing or heterocyclic group of binary ring (As substituent becomes lower alkyl group, phenyl group, lower alkanoyl group, halogen atom, phenyl lower alkyl group and oxo group 1 - 3 it is possible to said heterocyclic group to have possessed group which is chosen from group which); as cycloalkenyl group; phenyl lower alkyl amino carbonyl group; substituent - (A) m-CHR¹²R¹³ (As for A same to description above. R¹² shows hydrogen atom, hydroxy group or lower alkanoyl oxy group. R¹³ on phenyl ring shows phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent. m shows 0 or 1.) is shown.

)。

X methylene group, single bond, basis =CH- or basis -NR¹⁴- shows (R¹⁴ shows

ルカノイル基を示す。)を示す。

Y は-NR^A-を示す(R^A は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基-ACONR^BR^Cを示す。ここでR^B及びR^Cは、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこのR^B及びR^Cは、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5-7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す。

[0012]

本発明者らの研究によれば、上記一般式(1)のベンゾヘテロ環誘導体及びその塩は、優れたバソプレシン拮抗作用、オキシトシン拮抗作用及びバソプレシン作働作用を有することが見出された。

[0013]

上記一般式(1)において、下記一般式(1AA)で表されるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩は、文献未記載の新規化合物である。

[0014]

[化 23]

hydrogen atom, lower alkyl group or lower alkanoyl group .).

Y shows (hydrogen atom, lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group, carboxy substituted lower alkyl group or basis -ACONR^BR^C it shows R^A, R^B and R^C show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group here. In addition this R^B and R^C with nitrogen atom which these connect through nitrogen atom or oxygen atom or connecting mutually without minding, 5 - 7 - member ring may form saturated heterocycle . On said heterocycle lower alkyl group optionally substitutable .) which -NR^A- is shown.

[0012]

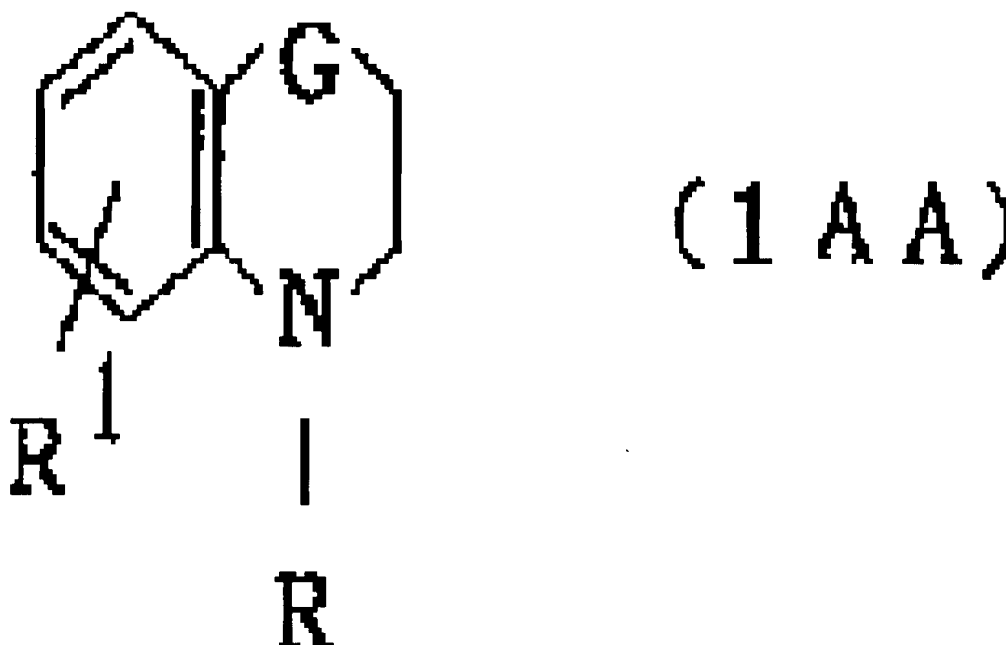
) According to research of these inventors, as for benzo heterocyclic derivative and its salt of the above-mentioned General Formula (1), it was discovered that it possesses the vasopressin antagonist action, oxytocin antagonist action and vasopressin work working action which are superior.

[0013]

In above-mentioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative and its salt which is displayed with the below-mentioned General Formula (1 AA) is novel compound of unrecorded in the literature .

[0014]

[Chemical Formula 23]



【0015】

〔式中 G、R¹ 及び R は前記に同じ。但し、R² が基 -NR⁴R⁵ (R⁴ 及び R⁵ が同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。)、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷ (m は 1、u は 0 又は 1 を示す。R⁶ 及び R⁷ が同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示すか、R⁶ 及び R⁷ がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく 5-6 員環の飽和複素環を形成する(該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい))、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基;又は R² と R³ が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する;R が基〕

【0016】

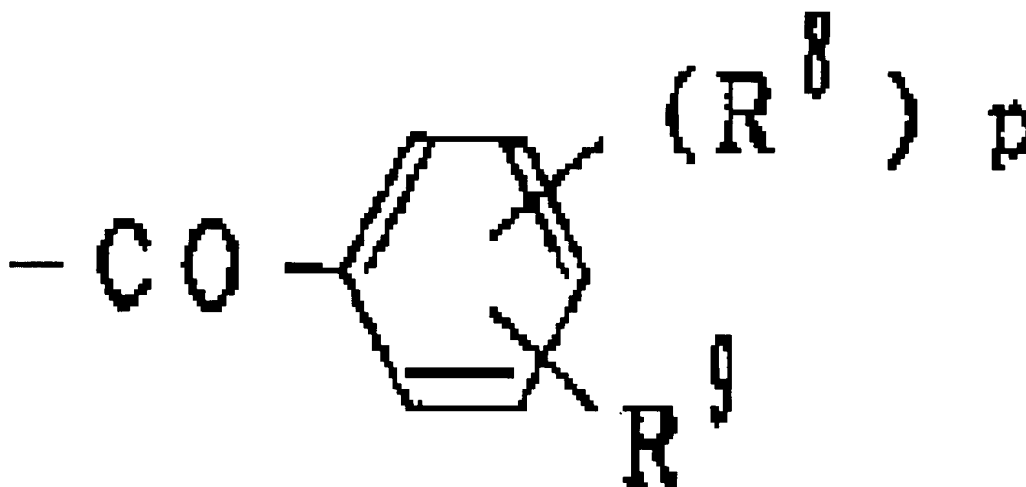
【化 24】

【0015】

As for m 1, as for u 0 or 1 are shown. 5 - 6 - member ring saturated heterocycle is formed without R⁶ and R⁷ show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group, or R⁶ and R⁷ with nitrogen atom which these connect through nitrogen atom or oxygen atom or binding (On said heterocycle lower alkyl group optionally substitutable), Or amino substitution lower alkanoyl oxy group; or R² and R³ which have times when it possesses lower alkyl group as substituent becoming simultaneous, forms oxo group or lower alkylidene group; R basis) As for G, R¹ and R in Formula same to description above. However, R² basis -NR⁴R⁵ (R⁴ and R⁵ show alike or different, hydrogen atom, lower alkyl group or benzoyl group.), hydrogen atom, hydroxy group, lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group, carboxyl substitution lower alkoxy group, lower alkoxy group, lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group, basis - (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷

【0016】

【Chemical Formula 24】



【0017】

であって、 R^8 が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、 R^9 は水素原子であってはならないし、また R^9 が基- $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ であって且つ R^{11} が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を 1~3 個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であってはならない。

また R^1 が水素原子で、 R^2 が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミノ基であるか、或いは R^2 と R^3 とが一緒になってオキシ基を形成するとき、 R^9 はフェニル環上に置換基として水酸基、低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはならない。

また R^9 が基

【0018】

【化 25】

【0017】

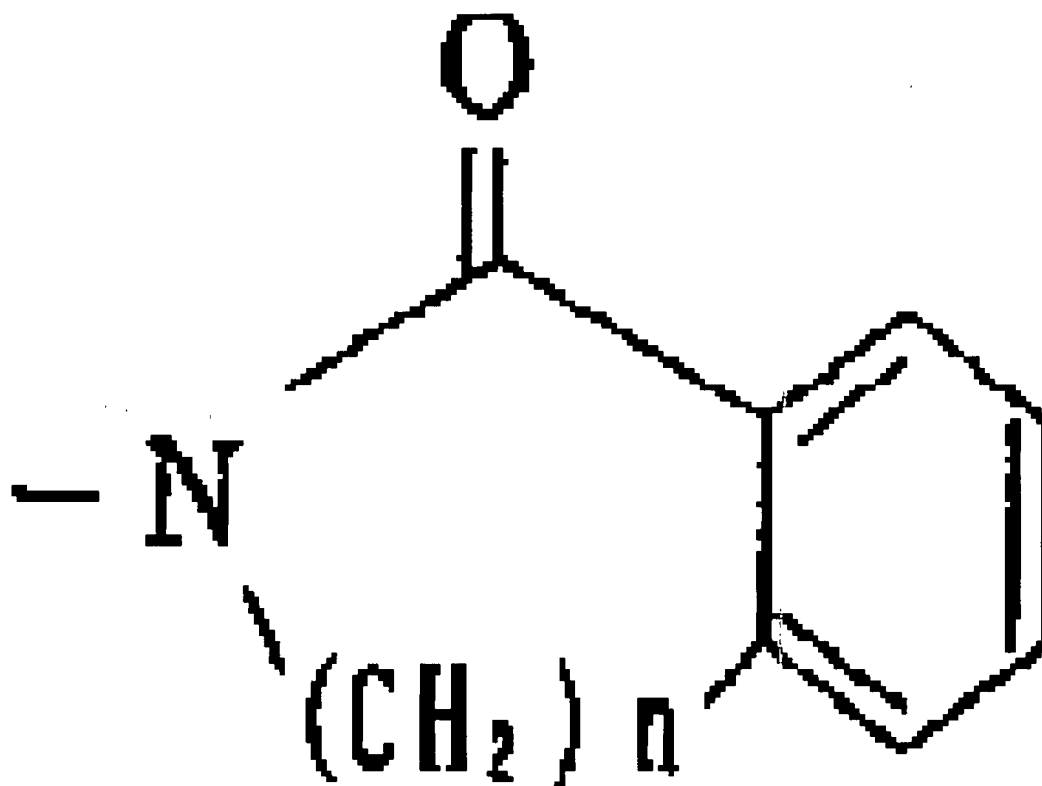
When so, $\text{R}^{8\text{sup}}$ shows hydrogen atom, lower alkyl group, hydroxy group, halogen atom, lower alkoxy group or amino group respectively, the $\text{R}^{9\text{sup}}$ does not become with hydrogen atom and, in addition $\text{R}^{9\text{sup}}$ basis- $\text{NR}^{10\text{sup}}\text{R}^{11\text{sup}}$, and $\text{R}^{11\text{sup}}$ on lower alkanoyl group, phenyl lower alkoxy carbonyl group or phenyl ring with phenoxy lower alkanoyl group which has fact that 1 - 3 it possesses group which is chosen does not become from group which becomes lower alkyl group, amino group, lower alkanoyl group substituted amino group and lower alkoxy group as the substituent.

In addition $\text{R}^{1\text{sup}}$ being hydrogen atom, $\text{R}^{2\text{sup}}$ is hydrogen atom, amino group, mono lower alkyl amino group or the di lower alkyl amino group, or or $\text{R}^{2\text{sup}}$ and $\text{R}^{3\text{sup}}$ become simultaneous and when forming oxo group, $\text{R}^{9\text{sup}}$ with phenyl group which has fact that it possesses hydroxy group, lower alkyl group, lower alkoxy group or lower alkanoyl oxy group as substituent does not become on the phenyl ring.

In addition $\text{R}^{9\text{sup}}$ basis

【0018】

【Chemical Formula 25】



【0019】

(n は 1 又は 2 を示す)、G が基

【0020】

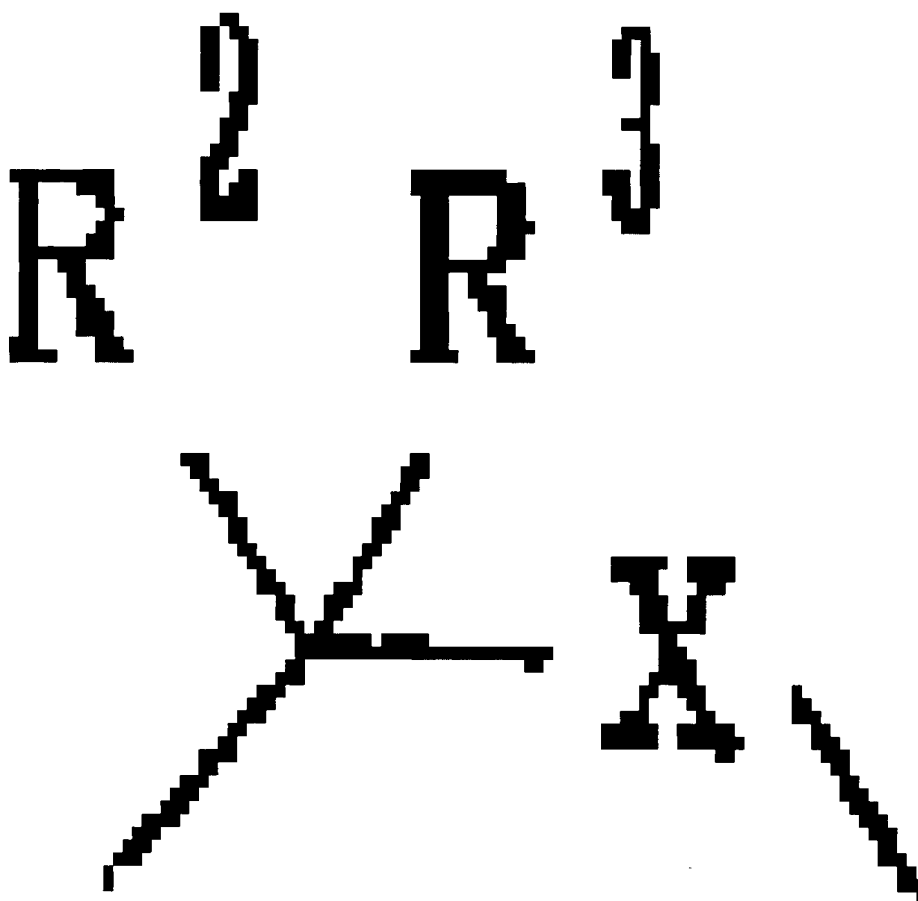
【化 26】

[0019]

(n shows 1 or 2 .) G basis

[0020]

[Chemical Formula 26.]



【0021】

(R^2 及び R^3 は前記に同じ)を示すとき、X はメチレン基又は基=CH-であってはならない。

また R^{10} 及び R^{11} は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはならない。

また R^1 及び R^2 が同時に水素原子を示すとき、R は無置換のピリジルカルボニル基、無置換のチエニルカルボニル基、無置換のチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基であってはならない。

[0021]

When showing (As for $R^{2\text{sup}}$ and $R^{3\text{sup}}$ same to description above), X does not become methylene group or with basis=CH-.

In addition as for $R^{10\text{sup}}$ or $R^{11\text{sup}}$, when it is a hydrogen atom on onehand, as for other with lower alkyl group it does not become.

In addition when $R^{1\text{sup}}$ and $R^{2\text{sup}}$ show hydrogen atom simultaneously, R does not become with unsubstituted pyridyl carbonyl group, unsubstituted thienyl carbonyl group, unsubstituted thiazolyl carbonyl group or cycloalkyl carbonyl group.

また R^1 、 R^2 及び R^3 が水素原子、G が基

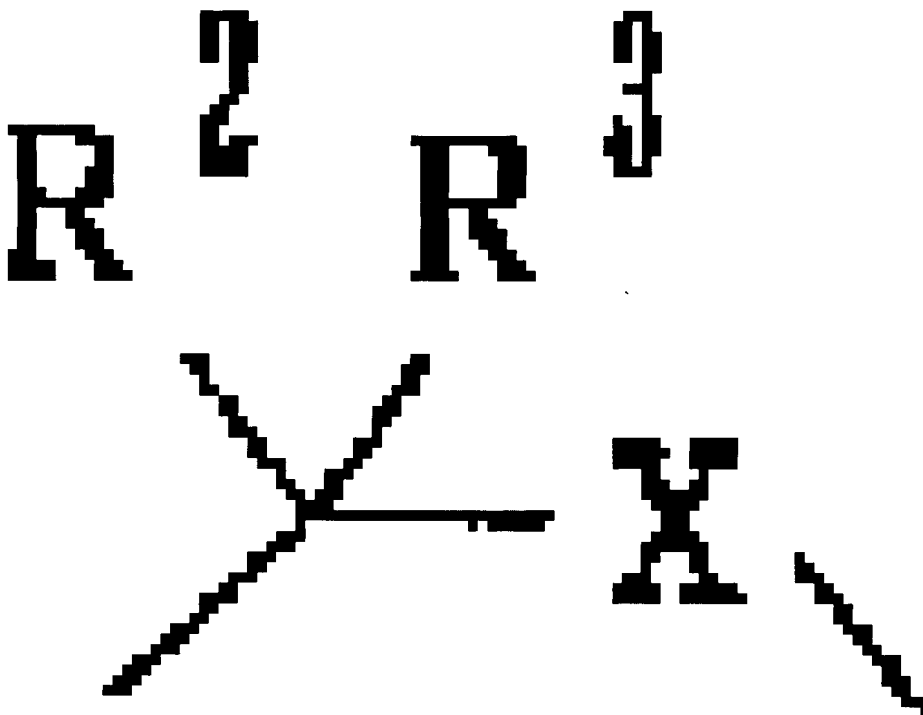
In addition $R^{¹}$, $R^{²}$ and $R^{³}$ hydrogen atom , G basis

【0022】

【0022】

【化 27】

[Chemical Formula 27 |



【0023】

(R^2 及び R^3 は前記に同じ)、X が単結合を示すとき、R は無置換のキノリルカルボニル基であってはならない。

【0023】

When (As for $R^{²}$ and $R^{³}$ same to description above), X shows single bond , R does not become with the unsubstituted quinolyl carbonyl group .

更に R^1 が水素原子、 R^2 が水素原子、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ基、基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m が 1、u が 0 又は 1 を示す。R⁶ 及び R⁷ は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)又は基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)を示すか、又は R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を示すとき、R⁹ は基-NR¹⁰R¹¹(R¹⁰ は低級アルキル基、R¹¹ は低級アルキル基を示す。)、水素原子、低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基又は低級アルキル基であってはならない。

Furthermore $R^{³}$ hydrogen atom , $R^{²}$ amino substitution lower alkanoyl oxy group , lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group , hydroxy group , lower alkoxy group , basis which has times when it possesses the lower alkyl group as hydrogen atom , substituent - (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (m 1, u 0 or 1 are shown. $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group .) or basis -NR⁴R⁵ shows($R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ show alike or different hydrogen atom or lower alkyl group .), or or $R^{²}$ and $R^{³}$ become simultaneous and whenshowing oxo group or lower alkylidene group , $R^{⁹}$ does not become basis -NR¹⁰R¹¹ (As for $R^{¹⁰}$ as for lower alkyl group , $R^{¹¹}$

]

本発明のバソプレシン拮抗用医薬組成物は、例えば血管拡張作用、血圧降下作用、肝糖放出抑制作用、メサングウム細胞増殖抑制作用、水利尿作用、血小板凝集抑制作用、嘔吐抑制作用、尿素排泄促進作用、第 VIII 因子分泌抑制作用、心機能亢進作用、メサングウム細胞収縮抑制作用、肝糖新生抑制作用、アルドステロン分泌抑制作用、エンドセリン産生抑制作用、レニン分泌調節作用、記憶調節作用、体温調節作用、プロスタグランジン産生調節作用等を有し、血管拡張剤、降圧剤、水利尿剤、血小板凝集抑制剤、尿素排泄促進剤、抗心不全剤、抗腎不全剤等として有用であり、高血圧、浮腫、腹水、心不全、腎機能障害、バソプレシン分泌異常症候群(SIADH)、肝硬変、低ナトリウム血症、低カリウム血症、糖尿病、循環不全、動揺病、水代謝障害、腎不全、各種虚血性疾患等の予防及び治療に有効である。

更に本発明の化合物は、副作用が少なく、薬効の持続時間が長いという特徴を有している。

【0024】

本発明のオキシトシン拮抗用医薬組成物は、例えば子宮平滑筋収縮抑制作用、乳汁放出抑制作用、プロスタグランジン合成及び放出抑制作用、血管拡張作用を有し、オキシトシン関連疾患、特に早期分娩、帝王切開前の出産の阻止、月経困難等の予防乃至治療に有効である。

【0025】

本発明のバソプレシン作用用医薬組成物は、様々な排尿障害、大量尿又は出血状態に有用であり、頻尿、尿崩症、尿失禁、遺尿症特に夜尿症、自然発生性出血、血友病、von Willebrand 病、尿毒症、先天的又は後天的血小板機能障害、外傷性及び手術時出血、肝硬変等の診断、予防乃至治療に有効である。

lower alkyl group is shown.), with hydrogen atom, lower alkyl thio group, lower alkoxy group or lower alkyl group .

)

pharmaceutical composition for vasopressin competition of this invention, has for example vasodilation, antihypertensive effect, liver sugar discharge inhibition, mesangial cell growth-suppressing action, water diuretic action, antithrombotic effect, vomiting inhibition, urea excretion promoting action, factor VIII secretion inhibition action, heart function accentuation effect, mesangial cell contraction inhibition, liver gluconeogenesis inhibition, aldosterone secretion inhibition action, endothelin production inhibition effect, renin secretion regulation, storage regulation, body temperature regulation action and prostaglandin production regulation etc, being useful as vasodilator, antihypertensive, water diuretic, platelet aggregation inhibition agent, urea excretion promoter, anti-heart failure agent, anti-renal failure agent etc, hypertension, edema, spleen, heart failure, renal function disorder, vasopressin secretion abnormality group (SIADH), liver cirrhosis, low sodium blood symptom and low potassium blood symptom, diabetes, circulatory failure, trembling illness, it is ineffective to water metabolism disorder, renal failure, various ischaemic disease or other prevention and treatment.

Furthermore as for compound of this invention, side effect is little, it has possessed feature that connect time of drug effect is long.

【0024】

pharmaceutical composition for oxytocin competition of this invention has for example uterus smooth muscle contraction inhibition, milk juice discharge inhibition, prostaglandin synthetic and discharge inhibition, vasodilation, it is effective to the obstruction and menstrual difficult or other prevention to treatment of oxytocin related disease, especially early stage childbirth and childbirth before * Wang incision.

【0025】

pharmaceutical composition for vasopressin work working of this invention, being useful in the various urinary injury, large scale urine or bleeding state, increased urinary frequency, urine crumbling symptom and urinary incontinence, leaving behind urine symptom especially night urine symptom, spontaneous generation characteristic bleeding, hemophilia, von Willebrand illness, at time of urinemia, congenital or acquired platelet function disorder, traumatic and surgery is effective to bleeding, liver cirrhosis or other diagnosis, prevention to treatment.

[0026]

【発明の実施の形態】

本発明の一般式(1)のベンゾヘテロ環誘導体には、下記の種々の態様の化合物が含まれる。

[0027]

(1) G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X がメチレン基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R がピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(2) G、X、R¹、R³ 及び R は前記(1)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(3) G、X、R¹、R³ 及び R は前記(1)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(4) G、X、R¹、R³ 及び R は前記(1)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(5) G、X、R¹、R³ 及び R は前記(1)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(6) G、X、R¹、R³ 及び R は前記(1)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

[0026]

[Embodiment of the Invention]

compound of below-mentioned various embodiment is included in benzo heterocyclic derivative of the General Formula (1) of this invention .

[0027]

(1) G basis -C(R²)(R³)-X to show -X-, X to show the methylene group, being same to definition R¹ in theaforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ to show (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the R³ hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group showing, R on pyridine ring as substituent on phenyl ring group which becomes phenyl group and pyridyl group which have times when it possesses lower alkyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a pyridyl carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen

As for (2) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (3) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (4) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (5) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (6) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (1), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

(7)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(8)G、X、 R^1 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(9)G、X、 R^1 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(10)G、X、 R^1 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0028】

(11)G、X、 R^1 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(12)G、X、 R^1 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(13)G が基- $C(R^2)(R^3)$ -Xを示し、X がメチレン基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(14)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で

As for (7) G, X, $R^{1¹}$, $R^{3³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{2²}$ is lower alkanoyl group

As for (8) G, X, $R^{1¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1), $R^{2²}$ and $R^{3³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (9) G, X, $R^{1¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1), $R^{2²}$ and $R^{3³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (10) G, X, $R^{1¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1), $R^{2²}$ and $R^{3³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

【0028】

As for (11) G, X, $R^{1¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1), $R^{2²}$ and $R^{3³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (12) G, X, $R^{1¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1), $R^{2²}$ and $R^{3³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

(13) G basis - $C(R^{2²})(R^{3³})$ shows -X-, X shows the methylene group , being same to definition $R^{1¹}$ in theaforementioned General Formula (1), $R^{2²}$ basis - $N(R^{4⁴})R^{5⁵}$ shows (As for $R^{4⁴}$ and $R^{5⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the $R^{3³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{9⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{8⁸}$ shows hydrogen atom .) where R is shownwith aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (14) G, X, $R^{1¹}$, $R^{3³}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo

表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(15)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(16)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(17)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(18)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(19)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(20)G、X、 R^1 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0029]

(21)G、X、 R^1 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(22)G、X、 R^1 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (15) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (16) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (17) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (18) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (19) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (20) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

[0029]

As for (21) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (22) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (13), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

(23) G, X, R¹ 及び R は前記(13)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(24) G, X, R¹ 及び R は前記(13)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(25) G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X がメチレン基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R⁹ 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸ は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(26) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(27) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(28) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(29) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(30) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオ

As for (23) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (13), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (24) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (13), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(25) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows the methylene group, being same to definition R¹ in theaforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). R⁸ shows lower alkyl group.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (26) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (27) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (28) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (29) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (30) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), R² benzo heterocyclic derivative or its salt.

キシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0030】

(31)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(25)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(32)G、X、 R^1 及びRは前記(25)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(33)G、X、 R^1 及びRは前記(25)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(34)G、X、 R^1 及びRは前記(25)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(35)G、X、 R^1 及びRは前記(25)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(36)G、X、 R^1 及びRは前記(25)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(37)Gが基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、Xがメチレン基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記[化5]で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

【0030】

As for (31) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (32) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (25), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (33) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (25), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (34) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (25), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (35) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (25), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (36) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (25), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

(37) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows the methylene group , being same to definition $R^{¹}$ in theaforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR R^4 R R^5 (R^4 and R^5 same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1).

(38) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(39) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(40) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0031】

(41) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(42) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(43) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(44) G, X, R¹ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(45) G, X, R¹ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(46) G, X, R¹ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置

R² shows hydroxy group .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (38) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (39) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (40) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

[0031]

As for (41) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (42) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (37), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (43) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (44) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (37), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (45) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (37), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (46) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (37), R² and R³

換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(47)G、X、 R^1 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(48)G、X、 R^1 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(49)Gが基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、Xがメチレン基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記[化5]で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(50)G、X、 R^1 、 R^2 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0032]

(51)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(52)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(53)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

$R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (47) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (37), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (48) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (37), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(49) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows the methylene group, being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -N $R^{⁴}$ R $R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows nitro group.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (50) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

[0032]

As for (51) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (52) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (53) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where

れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(54) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(55) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(56) G、X、 R^1 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(57) G、X、 R^1 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(58) G、X、 R^1 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(59) G、X、 R^1 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(60) G、X、 R^1 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0033】

(61) G が基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、X がメチレン基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前

R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (54) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (49), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (55) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (56) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (49), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (57) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (49), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (58) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (49), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (59) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (49), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (60) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (49), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

【0033】

(61) G basis -C(R²)(R³)-X- shows -X-, X shows the methylene group , being same to definition R¹ in theaforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵(R⁴ and R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to

記〔化 5〕で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(62) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(63) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(64) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(65) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(66) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(67) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(68) G、X、 R^1 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(69) G、X、 R^1 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベン

definition in theaforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows halogen atom .) where R is shown with aforesaid (Chemical Formula 5)

As for (62) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (63) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (64) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (65) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (66) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (61), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (67) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (68) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforesaid (61), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms oxo group

As for (69) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforesaid (61), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic

ゾヘテロ環誘導体又はその塩

(70)G、X、 R^1 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0034】

(71)G、X、 R^1 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(72)G、X、 R^1 及び R は前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(73)G が基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、X がメチレン基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(74)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(75)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(76)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (70) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (61), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt, which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

【0034】

As for (71) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (61), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (72) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (61), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(73) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows the methylene group, being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows lower alkoxy group.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (74) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (75) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (76) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

(77)G、X、R¹、R³及びRは前記(73)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(78)G、X、R¹、R³及びRは前記(73)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(79)G、X、R¹、R³及びRは前記(73)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(80)G、X、R¹及びRは前記(73)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0035】

(81)G、X、R¹及びRは前記(73)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(82)G、X、R¹及びRは前記(73)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(83)G、X、R¹及びRは前記(73)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(84)G、X、R¹及びRは前記(73)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (77) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (78) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (73), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (79) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (80) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (73), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

【0035】

As for (81) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (73), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (82) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (73), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (83) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (73), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (84) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (73), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

(85)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が基-NR¹⁴- (R¹⁴ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R がピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(86)G、X、R¹、R³及びRは前記(85)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(87)G、X、R¹、R³及びRは前記(85)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(88)G、X、R¹、R³及びRは前記(85)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(89)G、X、R¹、R³及びRは前記(85)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(90)G、X、R¹、R³及びRは前記(85)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0036]

(91)G、X、R¹、R³及びRは前記(85)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(85) G basis -C (R²) (R³) -X to show -X-, X basis -NR¹⁴- to show (As for R¹⁴ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition R¹ in theaforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ to show (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the R³ hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group showing, R on pyridine ring as substituent on phenyl ring group which becomes phenyl group and pyridyl group which have times when it possesses lower alkyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a pyridyl carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen

As for (86) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (87) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (88) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (89) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (90) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (85), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

[0036]

As for (91) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

(92) G, X, R¹ 及び R は前記(85)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(93) G, X, R¹ 及び R は前記(85)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(94) G, X, R¹ 及び R は前記(85)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(95) G, X, R¹ 及び R は前記(85)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(96) G, X, R¹ 及び R は前記(85)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(97) G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が基-NR¹⁴-(R¹⁴ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R⁹ 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸ は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(98) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is lower alkanoyl group

As for (92) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (85), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (93) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (85), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (94) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (85), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (95) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (85), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (96) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (85), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(97) G basis -C(R²)(R³)-X shows -X-, X basis -NR¹⁴- shows (As for R¹⁴ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition R¹ in the aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). R⁸ shows hydrogen atom.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (98) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

(99)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(100)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0037】

(101)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(102)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(103)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(104)G、X、R¹ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(105)G、X、R¹ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(106)G、X、R¹ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(107)G、X、R¹ 及び R は前記(97)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する

As for (99) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (100) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

[0037]

As for (101) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (102) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (97), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (103) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (104) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (97), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (105) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (97), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (106) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (97), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (107) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (97), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic

前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(108)G、X、 R^1 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(109)G が基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、X が基-NR¹⁴-(R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 は及び p 前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(110)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0038】

(111)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(112)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(109)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(113)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(114)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル

derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (108) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (97), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(109) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X basis -NR¹⁴- shows (As for $R^{¹⁴}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and same to definition in p aforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows lower alkyl group .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (110) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

[0038]

As for (111) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (112) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (113) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (114) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (109), $R^{²}$ as for benzo heterocyclic derivative or its salt

オキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(115)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(116)G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(117)G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(118)G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(119)G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(120)G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0039]

(121)Gが基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、Xが基-N R^{14} -(R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R^3 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記[化5]で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(115) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and the R which are displayed with aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses the lower alkyl group as substituent being same to definition of theaforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (116) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of afoforementioned (109), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (117) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of afoforementioned (109), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (118) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of afoforementioned (109), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (119) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of afoforementioned (109), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (120) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of afoforementioned (109), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

[0039]

(121) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X basis -N $R^{¹⁴}$ - shows (As for $R^{¹⁴}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition $R^{¹}$ in theaforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -N $R^{⁴}$ $R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows hydroxy group.) where R is

(122)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(123)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(124)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(125)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(126)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(127)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(128)G、X、 R^1 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(129)G、X、 R^1 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(130)G、X、 R^1 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

shownwith aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (122) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (123) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (124) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (125) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (126) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (127) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (128) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (129) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (130) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned

の塩。

【0040】

(131) G、X、 R^1 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(132) G、X、 R^1 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(133) G が基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、X が基-NR¹⁴-(R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(134) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(135) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(136) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(137) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

【0040】

As for (131) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (121), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (132) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (121), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(133) G basis -C($R^{²}$)($R^{³}$) shows -X-, X basis -NR¹⁴- shows (As for $R^{¹⁴}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows nitro group.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (134) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (135) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (136) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (137) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where

されるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(138)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(139)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(140)G、X、 R^1 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0041】

(141)G、X、 R^1 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(142)G、X、 R^1 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(143)G、X、 R^1 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(144)G、X、 R^1 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(145)G が基- $C(R^2)(R^3)-X$ を示し、X が基- NR^{14} (R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基- NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式

$R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (138) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (133), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (139) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (140) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (133), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

[0041]

As for (141) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (133), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (142) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (133), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (143) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (133), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (144) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (133), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(145) G basis - $C(R^{²})(R^{³})$ shows -X-, X basis - $NR^{¹⁴}$ shows (As for $R^{¹⁴}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis - $NR^{⁴}R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to

(1)における定義に同じ。R⁸ はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(146)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(145)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(147)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(145)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(148)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(145)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(149)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(145)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(150)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(145)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0042】

(151)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(145)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(152)G、X、R¹ 及び R は前記(145)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(153)G、X、R¹ 及び R は前記(145)の定義に同じ

definition in theaforementioned General Formula (1).), the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). R⁸ shows halogen atom .) where R is shownwith aforesaid (Chemical Formula 5)

As for (146) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (147) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (148) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (149) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (150) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (145), R² benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

【0042】

As for (151) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (152) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (145), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) whichforms oxo group

As for (153) G, X, R¹ and R being same to

であり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(154) G、X、 R^1 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(155) G、X、 R^1 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(156) G、X、 R^1 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(157) G が基- $C(R^2)(R^3)-X$ を示し、X が基- NR^{14} (R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基- NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(158) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(157)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(159) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(157)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(160) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(157)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

definition of aforementioned (145), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (154) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (145), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (155) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (145), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (156) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (145), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(157) G basis - $C(R^{²})(R^{³})-X$ shows -X-, X basis - $NR^{¹⁴}$ - shows (As for $R^{¹⁴}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).) being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis - $NR^{⁴}R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows lower alkoxy group.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (158) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (159) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (160) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where

口環誘導体又はその塩。

【0043】

(161)G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(162)G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(163)G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(164)G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(165)G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(166)G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(167)G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(168)G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(169)Gが基-C(R²)(R³)-Xを示し、Xがメチレン

R² is carboxy substituted lower alkyl group

【0043】

As for (161) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (162) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (157), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (163) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (164) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (157), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (165) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (157), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (166) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (157), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (167) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (157), R² and R³ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (168) G, X, R¹ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (157), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(169) G basis -C(R²)(R³)-X shows

基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基- NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R が 9-オキソフルオレンニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(170) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0044]

(171) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(172) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(173) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(174) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(175) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(176) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(177) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(169)の定義に同じ

-X-, X shows the methylene group, being same to definition $R^{¹}$ in theaforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ basis - $NR^{⁴}R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the R 9-oxo fluorenyl group is

As for (170) G , X , $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

[0044]

As for (171) G , X , $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (172) G , X , $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (173) G , X , $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (174) G , X , $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (175) G , X , $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (176) G , X , $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (177) G , X , $R^{¹}$ and R being same to

であり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(178)G、X、 R^1 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(179)G、X、 R^1 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(180)G、X、 R^1 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0045】

(181)G が基- $C(R^2)(R^3)-X$ を示し、X が基- NR^{14} (R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基- $NR^4(R^5)$ 及び R^3 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が9-オキソフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(182)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(183)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(184)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

definition ofaforementioned (169), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (178) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (179) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (180) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (169), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

【0045】

(181) G basis - $C(R^{²})(R^{³})$ shows -X-, X basis - $NR^{¹⁴}$ - shows (As for $R^{¹⁴}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition $R^{¹}$ in theaforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis - $NR^{⁴}(R^{⁵})$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , R 9 -oxo fluorenyl group is

As for (182) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (183) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (184) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

(185)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(181)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(186)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(181)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(187)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(181)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(188)G, X, R¹ 及び R は前記(181)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(189)G, X, R¹ 及び R は前記(181)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(190)G, X, R¹ 及び R は前記(181)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(191)G, X, R¹ 及び R は前記(181)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(192)G, X, R¹ 及び R は前記(181)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(193)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(194)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1)の

As for (185) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (186) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (181), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (187) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (188) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (181), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (189) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (181), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (190) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (181), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (191) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (181), R² and R³ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (192) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (181), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (193) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (194) G, X, R¹, R³ and R whichare displayed with

定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(195)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(196)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(197)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(198)G、X、 R^1 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(199)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(200)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0046】

(201)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(13)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is the lower alkoxy group being same to definition of aforementioned (1), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (195) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (196) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (197) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (198) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (199) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (200) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

【0046】

As for (201) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

(202)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(13)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(203)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(13)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(204)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(13)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(205)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(13)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(206)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(13)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m, u, A, R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(207)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(208)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(209)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(210)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置

As for (202) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (203) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (204) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (205) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (13), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (206) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (13), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (207) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (208) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (209) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (210) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo

換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0047】

(211)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(212)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(213)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(25)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(214)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(215)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(216)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(217)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(218)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(37)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基

heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

[0047]

As for (211) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (212) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (25), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (213) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (25), R^² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR^⁶R^⁷ (As for m, u, A, R^⁶ and R^⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (214) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is lower alkoxy group

As for (215) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is cyano substituted lower alkyl group

As for (216) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (217) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (218) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (37), benzo

置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(219)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(37)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(37)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(220)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(37)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0048】

(221)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(222)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(223)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(224)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(225)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(226)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(49)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコ

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (219) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (37), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (37) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (220) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (37), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

【0048】

As for (221) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (222) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (223) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (224) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (225) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (49), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (226) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (49), benzo

キシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(227)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(49)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(228)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(61)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(229)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(61)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(230)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(61)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0049】

(231)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(61)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(232)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(61)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(233)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(61)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(234)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(61)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (227) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (49), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (228) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (229) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (230) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (61), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

【0049】

As for (231) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (232) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (233) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (61), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (234) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (61), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its

(同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(235)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(236)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(237)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(238)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(239)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(240)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0050】

(241)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(242)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に

salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

As for (235) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (236) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (237) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (238) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (239) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (240) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (73), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

[0050]

As for (241) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (73), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

As for (242) G, X, R¹, R³ and R

同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(243)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(244)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(245)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(246)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(247)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(248)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(249)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(250)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

being same to definition ofaforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (243) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (244) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (245) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (246) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (247) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (85), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (248) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (85), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (249) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (250) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

誘導体又はその塩。

【0051】

(251)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(252)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(253)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(254)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(97)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(255)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O) m -A-(CO) u NR 6 R 7 (m 、 u 、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(256)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(257)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(109)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(258)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(109)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

$R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

【0051】

As for (251) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (252) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (253) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (254) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (97), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (97) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (255) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m -A- (CO) u NR ⁶ R ⁷ (As for m , u , A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (256) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (257) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (258) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl

(259)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(109)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(260)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(109)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0052】

(261)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(109)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(262)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(109)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(263)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(121)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(264)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(121)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(265)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(121)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(266)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(121)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

group

As for (259) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (260) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

【0052】

As for (261) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (109), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (262) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (109), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (263) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (264) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (265) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (266) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted

(267)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(268)G、X、 R^1 及び R は前記(121)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(121)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(269)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(270)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0053】

(271)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(272)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(273)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(274)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

lower alkyl group

As for (267) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (268) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (121), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (121) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (269) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (270) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

【0053】

As for (271) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (272) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (273) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (274) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution

(275)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(276)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(133)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(277)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(278)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(279)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(280)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0054】

(281)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(282)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(145)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(145)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

lower alkoxy group

As for (275) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (133), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (276) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (133), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (277) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (278) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (279) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (280) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

【0054】

As for (281) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (282) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (145), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (145) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

(283)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(1)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(284)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(157)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(285)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(157)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(286)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(157)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(287)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(157)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(288)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(157)の定義に同じであり、R² が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(289)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(157)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(157)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(290)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(1)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

As for (283) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (284) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (285) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (286) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (287) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (288) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (289) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (157), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (157) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (290) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

【0055】

(291)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(292)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(293)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(294)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(295)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(296)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(297)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(169)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(298)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(299)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に

【0055】

As for (291) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (292) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (293) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (294) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (295) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (296) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (297) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (169), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (298) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (299) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R

同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(300)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0056】

(301)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(302)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(303)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(304)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(181)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(305)G が基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、X がメチレン基を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び P は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (300) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

【0056】

As for (301) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (302) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (303) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (304) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (181), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷(As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(305) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows the methylene group , $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition the $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows the(As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1)which is a group (As for $R^{⁹}$ and P same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows amino group which has fact that it possesses the lower alkanoyl group as

(306)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(307)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(308)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(309)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(310)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0057】

(311)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(312)G、X、 R^1 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(313)G、X、 R^1 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(314)G、X、 R^1 及び R は前記(305)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ

substituent.) where R is shown with
aforementioned(Chemical Formula 5)

As for (306) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (307) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (308) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (309) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (310) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

【0057】

As for (311) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (312) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (313) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (314) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (305), $R^{²}$ and

置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(315)G、X、 R^1 及びRは前記(305)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(316)G、X、 R^1 及びRは前記(305)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(317)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(305)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(318)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(305)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(319)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(305)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(320)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(305)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0058】

(321)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(305)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(322)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(305)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

$R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (315) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (305), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (316) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (305), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (317) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (318) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (319) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (320) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

[0058]

As for (321) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (322) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (305), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

(323) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(305)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m, u, A, R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(324) G が基-C(R²)(R³)-X-を示し、X がメチレン基を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(325) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(326) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(327) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(328) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(329) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (323) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (305), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

(324) G basis -C (R²) (R³) -X- shows -X-, X shows the methylene group, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition the R¹ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a quinolyl carbonyl group which has times when R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), R on quinoline ring possesses phenyl group as substituent

As for (325) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (326) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (327) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (328) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (329) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (324), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

(330)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0059】

(331)G、X、 R^1 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(332)G、X、 R^1 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(333)G、X、 R^1 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(334)G、X、 R^1 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(335)G、X、 R^1 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(336)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(337)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(338)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(324)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

As for (330) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

[0059]

As for (331) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (324), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (332) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (324), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (333) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (324), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (334) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (324), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (335) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (324), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (336) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (337) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (338) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl

(339)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(340)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0060]

(341)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(342)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(324)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m, u, A, R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(343)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X がメチレン基を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(344)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(345)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(346)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に

group

As for (339) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (340) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

[0060]

As for (341) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (324), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (342) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (324), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(343) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows the methylene group , R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition the R¹ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows the(As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1)where R is adamantyl carbonyl group

As for (344) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (345) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (346) G, X, R¹, R³ and R

同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(347)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(348)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(349)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(350)G、X、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0061]

(351)G、X、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(352)G、X、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(353)G、X、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(354)G、X、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (347) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (348) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (343), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (349) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (350) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (343), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

[0061]

As for (351) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (343), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (352) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (343), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (353) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (343), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (354) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (343), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula

(355) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(356) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(357) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(358) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(359) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(360) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0062]

(361) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(343)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(362) G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X がメチレン基を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、

(1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (355) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (356) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (357) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (358) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (359) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (360) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

[0062]

As for (361) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (343), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷(As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(362) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows the methylene group , R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition the R¹ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic.

R がチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(363)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(364)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(365)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(366)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(367)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(368)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(369)G、X、 R^1 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(370)G、X、 R^1 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a thienyl carbonyl group which has times when $R^{2/5}$ basis

$-NR^{4/5}$ shows (As for $R^{4/5}$ and $R^{5/5}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), R on thiophene ring possesses phenyl group as substituent

As for (363) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is hydrogen atom

As for (364) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is hydroxy group

As for (365) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is carboxy substituted lower alkyl group

As for (366) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (367) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (362), R^2 benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (368) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is lower alkanoyl group

As for (369) G, X, R^1 and R being same to definition of aforementioned (362), R^2 and R^3 becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (370) G, X, R^1 and R being same to definition of aforementioned (362), R^2 and R^3 becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned

ンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0063】

(371)G、X、 R^1 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(372)G、X、 R^1 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(373)G、X、 R^1 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(374)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(375)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(376)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(377)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(378)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(379)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に

General Formula (1) which forms lower alkylidene group

[0063]

As for (371) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforesaid (362), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (372) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforesaid (362), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (373) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforesaid General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforesaid (362), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (374) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (375) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (376) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (377) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (378) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (379) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R

同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(380)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0064】

(381)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X がメチレン基を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(382)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(383)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(384)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(385)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(386)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル

being same to definition ofaforementioned (362), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (380) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (362), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷(As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

【0064】

(381) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows the methylene group , $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition the $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a thiazolyl carbonyl group which has timeswhen $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), R on thiazole ring possesses phenyl group as substituent

As for (382) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (383) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (384) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (385) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (386) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt

オキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(387)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(388)G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(389)G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(390)G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0065】

(391)G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(392)G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(393)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(394)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (387) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (388) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (389) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (390) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

【0065】

As for (391) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (392) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (393) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (394) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

(395)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(396)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(397)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(398)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(399)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(400)G が基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、X がメチレン基を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0066]

(401)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(400)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(402)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(400)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で

As for (395) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (396) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (397) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (398) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (399) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (381), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(400) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows the methylene group , $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition the $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows the(As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1)where R is cycloalkyl carbonyl group

[0066]

As for (401) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (402) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo

表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(403)G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(404)G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(405)G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(406)G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(407)G、X、R¹及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキソ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(408)G、X、R¹及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(409)G、X、R¹及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(410)G、X、R¹及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (403) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (404) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (405) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (406) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (407) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (400), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (408) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (400), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (409) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (400), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (410) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (400), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

[0067]

(411) G, X, R¹ 及び R は前記(400)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(412) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(400)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(413) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(400)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(414) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(400)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(415) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(400)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(416) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(400)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(417) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(400)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(418) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(400)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

[0067]

As for (411) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (400), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (412) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (413) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (414) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (415) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (416) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (417) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (418) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (400), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(419)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が基-NR¹⁴- (R¹⁴ は前記一般式(1)における定義に同じ。)基を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記[化 5]で示される基(R⁹ 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸ は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(420)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(419)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0068】

(421)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(419)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(422)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(419)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(423)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(419)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(424)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(419)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(425)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(419)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導

(419) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X basis -NR¹⁴- (As for R¹⁴ same to definition in aforementioned General Formula (1).) shows basis, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to the definition R¹ in aforementioned General Formula (1), R² basis-NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). R⁸ shows amino group which has fact that it possesses the lower alkanoyl group as substituent.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (420) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt. which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

【0068】

As for (421) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (422) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (423) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (424) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (419), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (425) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with

体又はその塩

(426)G、X、 R^1 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(427)G、X、 R^1 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(428)G、X、 R^1 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(429)G、X、 R^1 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(430)G、X、 R^1 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0069】

(431)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(432)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(433)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(434)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(419)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置

theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (426) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (419), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (427) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (419), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (428) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (419), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (429) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (419), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (430) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (419), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

【0069】

As for (431) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (432) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (433) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (434) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (419), benzo

換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(435)G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(436)G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(437)G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(438)Gが基-C(R²)(R³)-Xを示し、Xが基-NR¹⁴を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹及びR¹⁴が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(439)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(440)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0070】

(441)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテ

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (435) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (436) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (419), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (437) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (419), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(438) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows basis-NR¹⁴-, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition R¹ and R¹⁴ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).) showing, R on quinoline ring benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a quinolyl carbonyl group which has times when itpossesses phenyl group as substituent

As for (439) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (440) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

【0070】

As for (441) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with

口環誘導体又はその塩

(442)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(443)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(444)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(445)G、X、 R^1 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(446)G、X、 R^1 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(447)G、X、 R^1 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(448)G、X、 R^1 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(449)G、X、 R^1 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(450)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(438)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記

theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (442) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (443) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (438), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (444) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (445) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (438), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (446) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (438), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (447) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (438), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (448) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (438), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (449) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (438), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (450) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo

一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0071】

(451)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(452)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(453)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(454)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(455)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(456)G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(457)Gが基-C(R²)(R³)-Xを示し、Xが基-NR¹⁴-を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹及びR¹⁴が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

[0071]

As for (451) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group .

As for (452) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (453) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (454) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (455) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (456) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (438), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(457) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows basis-NR¹⁴-, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition R¹ and R¹⁴ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with

(458)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(459)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(460)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0072】

(461)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(462)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(463)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(464)G、X、R¹ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(465)G、X、R¹ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(466)G、X、R¹ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ

theaforementioned General Formula (1) where R is adamantyl carbonyl group

As for (458) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (459) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (460) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

[0072]

As for (461) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (462) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (457), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (463) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (464) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (457), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (465) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (457), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (466) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (457), R² and

置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(467)G、X、 R^1 及び R は前記(457)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(468)G、X、 R^1 及び R は前記(457)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(469)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(457)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(470)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(457)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0073]

(471)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(457)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(472)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(457)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(473)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(457)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(474)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(457)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

$R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (467) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (457), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (468) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (457), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (469) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (470) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

[0073]

As for (471) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (472) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (473) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (474) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (457), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

(475) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(457)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(476) G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が基-NR¹⁴-を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ 及び R¹⁴ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(477) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(478) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(479) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(480) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0074]

(481) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (475) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (457), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(476) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows basis-NR¹⁴-, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition R¹ and R¹⁴ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).) showing, R on thiophene ring benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a thienyl carbonyl group which has times when itpossesses phenyl group as substituent

As for (477) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (478) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (479) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (480) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

[0074]

As for (481) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (476), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as

(482) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(483) G, X, R¹ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(484) G, X, R¹ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(485) G, X, R¹ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(486) G, X, R¹ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(487) G, X, R¹ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(488) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(489) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(490) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(476)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

substituent

As for (482) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (483) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (476), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (484) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (476), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (485) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (476), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (486) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (476), R² and R³ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (487) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition ofaforementioned (476), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (488) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (489) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (490) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl

【0075】

(491)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(476)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(492)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(476)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(493)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(476)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(494)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(476)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(495)G が基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、X が基-NR¹⁴-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 及び R^{14} が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(496)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(497)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

group

【0075】

As for (491) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (492) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (493) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (476), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (494) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (476), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith afoforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(495) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis-NR¹⁴-, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition $R^{¹}$ and $R^{¹⁴}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).) showing, R on thiazole ring benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a thiazolyl carbonyl group which has times when itpossesses phenyl group as substituent

As for (496) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (497) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

(498)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(499)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(500)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0076]

(501)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(502)G、X、R¹及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(503)G、X、R¹及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(504)G、X、R¹及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(505)G、X、R¹及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(506)G、X、R¹及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前

R² is hydroxy group

As for (498) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (499) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (500) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (495), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

[0076]

As for (501) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (502) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (495), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (503) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (495), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (504) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (495), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (505) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (495), R² and R³ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (506) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of

記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(507)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(508)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(509)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(510)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0077】

(511)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(512)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(513)G、X、R¹、R³及びRは前記(495)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(514)Gが基-C(R²)(R³)-Xを示し、Xが基-NR¹⁴-を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級ア

forementioned (495), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (507) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (508) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (509) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (510) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt, which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

【0077】

As for (511) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (512) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (495), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (513) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (495), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

(514) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows basis-NR¹⁴-, R³ shows

ルキル基を示し、 R^1 及び R^{14} が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基- NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(515)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(516)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(517)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(518)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(519)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(520)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0078]

(521)G、X、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition $R^{¹}$ and $R^{¹⁴}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis - $NR^{⁴}R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R is cycloalkyl carbonyl group

As for (515) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (516) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (517) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (518) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (519) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (514), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (520) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

[0078]

As for (521) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (514), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

(522)G、X、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(523)G、X、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(524)G、X、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(525)G、X、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(526)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(527)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(528)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(529)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(530)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

As for (522) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (514), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (523) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (514), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (524) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (514), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (525) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (514), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (526) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (527) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (528) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (529) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (530) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution

[0079]

(531) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(514)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(532) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(514)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体またはその塩

(533) G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が単結合を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジン基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(534) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(535) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(536) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(537) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

lower alkoxy group

[0079]

As for (531) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (514), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where R² is carboxyl substituted lower alkoxy group

As for (532) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (514), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforesaid General Formula (1).)

(533) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows the single bond, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition the R¹ in aforesaid General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforesaid General Formula (1).) showing, R on pyridine ring as substituent on phenyl ring group which becomes phenyl group and pyridine group which have times when it possesses lower alkyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) which is a pyridyl carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen

As for (534) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (535) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (536) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (537) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower

(538) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(539) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(540) G, X, R¹ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0080]

(541) G, X, R¹ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(542) G, X, R¹ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(543) G, X, R¹ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(544) G, X, R¹ 及び R は前記(533)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(545) G が基-C(R²)(R³)-X-を示し、X が単結合を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記[化 5]で示される基(R⁹ 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸ は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘ

alkyl group

As for (538) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (533), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (539) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (540) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (533), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

[0080]

As for (541) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (533), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (542) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (533), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (543) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (533), R² and R³ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (544) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (533), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(545) G basis -C (R²) (R³) -X- shows -X-, X shows the single bond , R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition the R¹ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows the (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic

テロ環誘導体又はその塩

(546)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(547)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(548)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(549)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(550)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0081】

(551)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(552)G、X、R¹及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0082】

(553)G、X、R¹及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベ

derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). R⁸ shows hydrogen atom .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (546) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (547) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (548) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (549) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (550) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (545), R² benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

【0081】

As for (551) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (552) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (545), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

【0082】

As for (553) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (545), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic

ンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(554) G、X、 R^1 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(555) G、X、 R^1 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(556) G、X、 R^1 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(557) G が基-C(R^2)(R^3)-Xを示し、X が単結合を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(558) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(557)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(559) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(557)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(560) G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(557)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0083】

derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (554) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (545), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (555) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (545), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (556) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (545), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(557) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows the single bond, being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴(R^4 and R^5 are same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1).), $R^{⁸}$ shows lower alkyl group. where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (558) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (559) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (560) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

【0083】

(561) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(557)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(562) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(557)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(563) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(557)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(564) G, X, R¹ 及び R は前記(557)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(565) G, X, R¹ 及び R は前記(557)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(566) G, X, R¹ 及び R は前記(557)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(567) G, X, R¹ 及び R は前記(557)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (568) G, X, R¹ 及び R は前記(557)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(569) G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が単結合を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前

As for (561) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (562) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (557), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (563) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (564) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (557), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (565) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (557), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (566) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (557), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (567) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (557), R² and R³ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (568) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (557), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(569) G basis -C(R²)(R³)-X shows -X-, X shows the single bond, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition the R¹ in

記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記[化 5]で示される基(R⁹及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸ は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(570)G、X、R¹、R³及び R は前記(569)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0084】

(571)G、X、R¹、R³及び R は前記(569)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(572)G、X、R¹、R³及び R は前記(569)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(573)G、X、R¹、R³及び R は前記(569)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(574)G、X、R¹、R³及び R は前記(569)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(575)G、X、R¹、R³及び R は前記(569)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(576)G、X、R¹及び R は前記(569)の定義に同じであり、R²と R³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows the (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). R⁸ shows hydroxy group .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (570) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

[0084]

As for (571) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (572) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (573) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (574) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (569), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (575) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (576) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (569), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

(577)G、X、R¹及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(578)G、X、R¹及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(579)G、X、R¹及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(580)G、X、R¹及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0085】

(581)Gが基-C(R²)(R³)-Xを示し、Xが単結合を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記[化5]で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は低級ニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(582)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(583)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(584)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテ

As for (577) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (569), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (578) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (569), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (579) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (569), R² and R³ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (580) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (569), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

[0085]

(581) G basis -C (R²) (R³) shows -X-, X shows the single bond , being same to definition R¹ in theaforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ (R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). R⁸ shows lower nitro group .) where R is shownwith aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (582) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (583) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (584) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with

口環誘導体又はその塩

(585)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(581)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(586)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(581)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(587)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(581)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(588)G、X、 R^1 及び R は前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(589)G、X、 R^1 及び R は前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(590)G、X、 R^1 及び R は前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0086】

(591)G、X、 R^1 及び R は前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(592)G、X、 R^1 及び R は前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

theaforementioned General Formula (1) where

$R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (585) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (586) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (581), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (587) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (588) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (581), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (589) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (581), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (590) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (581), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

[0086]

As for (591) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (581), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (592) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (581), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower

(593)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が単結合を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴及び R⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記[化 5]で示される基(R⁹及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸ はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(594)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(595)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(596)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(597)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(598)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(599)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(600)G、X、R¹ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成

alkylidene group

(593) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows the single bond, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition the R¹ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows the (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). R⁸ shows halogen atom.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (594) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (595) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (596) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (597) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (598) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (593), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (599) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (600) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (593), R² and

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0087]

(601)G、X、R¹及びRは前記(593)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(602)G、X、R¹及びRは前記(593)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(603)G、X、R¹及びRは前記(593)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(604)G、X、R¹及びRは前記(593)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(605)Gが基-C(R²)(R³)-Xを示し、Xが単結合を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(606)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(607)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt, which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

[0087]

As for (601) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (593), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (602) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (593), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (603) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (593), R² and R³ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (604) G, X, R¹ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (593), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(605) G basis -C(R²)(R³)-X shows -X-, X shows the single bond, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition the R¹ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows the (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). R⁸ shows lower alkyl group.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (606) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (607) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

(608)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(609)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(610)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0088】

(611)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(612)G、X、R¹及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(613)G、X、R¹及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(614)G、X、R¹及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(615)G、X、R¹及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(616)G、X、R¹及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

As for (608) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (609) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (610) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), R² benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

【0088】

As for (611) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (612) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (605), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (613) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (605), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (614) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (605), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (615) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (605), R² and R³ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (616) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (605), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its

体又はその塩

(617)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が単結合を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が 9-オキソフルオレンニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(618)G、X、R¹、R³及びR は前記(617)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(619)G、X、R¹、R³及びR は前記(617)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(620)G、X、R¹、R³及びR は前記(617)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0089】

(621)G、X、R¹、R³及びR は前記(617)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(622)G、X、R¹、R³及びR は前記(617)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(623)G、X、R¹、R³及びR は前記(617)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(624)G、X、R¹及びR は前記(617)の定義に同じ

salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(617) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X shows the single bond, being same to definition R¹ in the aforementioned General Formula (1), R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where R² basis-NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), R 9-oxo fluorenyl group is

As for (618) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (619) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (620) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

[0089]

As for (621) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (622) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (617), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (623) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (624) G, X, R¹ and R being same to

であり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキソ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(625)G、X、 R^1 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(626)G、X、 R^1 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(627)G、X、 R^1 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(628)G、X、 R^1 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(629)G が基- $C(R^2)(R^3)-X$ を示し、X が単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基- NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(630)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0090]

(631)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で

definition ofaforementioned (617), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (625) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (617), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (626) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (617), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (627) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (617), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (628) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (617), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(629) G basis -C ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows the single bond , $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition the $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis - $NR^{⁴}$ $R^{⁵}$ shows the (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1)which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows amino group which has fact that it possesses the lower alkanoyl group as substituent .) where R is shown with aforementioned(Chemical Formula 5)

As for (630) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

[0090]

As for (631) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), benzo

表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(632)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(633)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(634)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(635)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(636)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(637)G、X、 R^1 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(638)G、X、 R^1 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(639)G、X、 R^1 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(640)G、X、 R^1 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (632) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (633) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (634) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (635) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (636) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (637) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (638) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (639) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (629), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (640) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution

フェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0091]

(641)G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(642)G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(643)G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(644)G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(645)G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(646)G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(647)G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(648)Gが基-C(R²)(R³)-Xを示し、Xが単結合を

lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (629), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

[0091]

As for (641) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (642) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (643) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (644) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (645) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (646) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (629), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (647) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (629), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(648) G basis -C (R²) (R³) (X) shows

示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基- NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(649)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(650)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0092】

(651)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(652)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(653)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(654)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(655)G、X、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

-X-, X shows the single bond, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition the $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a quinolyl carbonyl group which has times when $R^{²}$ basis - $NR^{⁴}R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), R on quinoline ring possesses phenyl group as substituent

As for (649) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (650) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

【0092】

As for (651) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (652) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (653) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (648), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (654) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (655) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (648), $R^{²}$ and becoming $R^{³}$ simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned

導体又はその塩

(656)G、X、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(657)G、X、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がと R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(658)G、X、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(659)G、X、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(660)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0093]

(661)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(662)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(663)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(664)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基

General Formula (1) which forms oxo group

As for (656) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforesaid (648), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (657) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforesaid (648), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (658) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforesaid (648), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (659) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforesaid General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforesaid (648), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (660) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

[0093]

As for (661) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (662) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (663) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforesaid General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (664) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforesaid (648), benzo

置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(665)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(666)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(667)G が基(R^2)(R^3)-Xを示し、X が単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(668)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(667)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(669)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(667)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(670)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(667)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0094】

(671)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(667)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (665) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (648), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (666) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (648), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith afoforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷(As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(667) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows single bond, the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition $R^{¹}$ in afoforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with afoforementioned General Formula (1) where the R is adamantyl carbonyl group

As for (668) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (669) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (670) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

【0094】

As for (671) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower

(672)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(673)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(674)G, X, R¹ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(675)G, X, R¹ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(676)G, X, R¹ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(677)G, X, R¹ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(678)G, X, R¹ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(679)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(680)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(667)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

alkyl group

As for (672) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (667), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (673) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (674) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (667), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (675) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (667), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (676) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (667), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (677) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (667), R² and R³ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (678) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (667), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (679) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (680) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

誘導体又はその塩。

【0095】

(681)G、X、R¹及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(682)G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(683)G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(684)G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(685)G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(686)Gが基(R²)(R³)-Xを示し、Xが単結合を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(687)G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is cyano substituted lower alkyl group

【0095】

As for (681) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (682) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (683) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (684) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (667), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (685) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (667), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(686) G basis (R²) (R³) shows -X-, X shows single bond, the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition R¹, inaforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a thienyl carbonyl group which has times when the R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), R on thiophene ring possesses the phenyl group as substituent

As for (687) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

(688)G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(689)G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(690)G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0096】

(691)G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(692)G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(693)G、X、R¹及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキソ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(694)G、X、R¹及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(695)G、X、R¹及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(696)G、X、R¹及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ

R² is hydrogen atom

As for (688) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (689) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (690) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

【0096】

As for (691) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (686), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (692) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (693) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (686), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (694) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (686), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (695) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (686), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (696) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (686), R² and

カルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(697)G、X、 $R^{1\leq}$ 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(698)G、X、 $R^{1\leq}$ 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(699)G、X、 $R^{1\leq}$ 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(700)G、X、 $R^{1\leq}$ 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0097】

(701)G、X、 $R^{1\leq}$ 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(702)G、X、 $R^{1\leq}$ 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(703)G、X、 $R^{1\leq}$ 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(704)G、X、 $R^{1\leq}$ 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

$R^{3\leq}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (697) G, X, $R^{1\leq}$ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (686), $R^{2\leq}$ and $R^{3\leq}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (698) G, X, $R^{1\leq}$, $R^{3\leq}$ and R being same to definition of aforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2\leq}$ is lower alkoxy group

As for (699) G, X, $R^{1\leq}$, $R^{3\leq}$ and R being same to definition of aforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2\leq}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (700) G, X, $R^{1\leq}$, $R^{3\leq}$ and R being same to definition of aforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2\leq}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

【0097】

As for (701) G, X, $R^{1\leq}$, $R^{3\leq}$ and R being same to definition of aforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2\leq}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (702) G, X, $R^{1\leq}$, $R^{3\leq}$ and R being same to definition of aforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2\leq}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (703) G, X, $R^{1\leq}$, $R^{3\leq}$ and R being same to definition of aforementioned (686), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2\leq}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (704) G, X, $R^{1\leq}$, $R^{3\leq}$ and R being same to definition of aforementioned (686), $R^{2\leq}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A,

(705)G が基(R²)(R³)-X-を示し、X が単結合を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(706)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(707)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(708)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(709)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(710)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0098】

(711)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R^{sup>6} and R^{sup>7} same to definition in theaforementioned General Formula (1).)</sup></sup>

(705) G basis (R^{sup>2}) (R^{sup>3}) shows -X-, X shows single bond , the R^{sup>3} shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition R^{sup>2} in theaforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a thiazolyl carbonyl group which has times when the R^{sup>2} basis -NR^{sup>4}R^{sup>5} shows (As for R^{sup>4} and R^{sup>5} same to definition in theaforementioned General Formula (1).), R on thiazole ring possesses the phenyl group as substituent</sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup>

As for (706) G, X, R^{sup>1}, R^{sup>3} and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^{sup>2} is hydrogen atom</sup></sup></sup>

As for (707) G, X, R^{sup>1}, R^{sup>3} and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^{sup>2} is hydroxy group</sup></sup></sup>

As for (708) G, X, R^{sup>1}, R^{sup>3} and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^{sup>2} is carboxy substituted lower alkyl group</sup></sup></sup>

As for (709) G, X, R^{sup>1}, R^{sup>3} and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^{sup>2} is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group</sup></sup></sup>

As for (710) G, X, R^{sup>1}, R^{sup>3} and R being same to definition ofaforementioned (705), R^{sup>2} benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent</sup></sup></sup>

【0098】

As for (711) G, X, R^{sup>1}, R^{sup>3} and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^{sup>2} is lower alkanoyl group</sup></sup></sup>

(712)G、X、R¹及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(713)G、X、R¹及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(714)G、X、R¹及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(715)G、X、R¹及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(716)G、X、R¹及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(717)G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(718)G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(719)G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(720)G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

As for (712) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (705), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (713) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (705), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (714) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (705), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

TRANSLATION STALLED R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group G, X, R¹ and R³ lower alkoxy carbonyl lower alkylidene group General Formula benzo heterocyclic derivative or its salt G, X, R¹ and R³

As for (717) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (718) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (719) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (720) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

【0099】

[0099]

(721)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(722)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(723)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(705)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m, u, A, R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(724)G が基(R²)(R³)-X-を示し、X が単結合を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(725)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(726)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(727)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(728)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

As for (721) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (722) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (705), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (723) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (705), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷(As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(724) G basis (R²) (R³) -X- shows -X-, X shows single bond, the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition R¹ in theaforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the R is cycloalkyl carbonyl group

As for (725) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (726) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (727) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (728) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower

(729) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(730) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0100]

(731) G, X, R¹ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(732) G, X, R¹ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(733) G, X, R¹ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(734) G, X, R¹ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(735) G, X, R¹ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(736) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(724)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(737) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(724)の定義に

R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (729) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (724), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (730) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

[0100]

As for (731) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (724), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (732) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (724), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (733) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (724), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (734) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (724), R² and R³ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (735) G, X, R¹ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (724), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (736) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (737) G, X, R¹, R³ and R

同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(738)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(724)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(739)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(724)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(740)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(724)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0101】

(741)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(724)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(742)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(724)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(743)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(744)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(745)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキ

being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (738) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (739) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (740) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

【0101】

As for (741) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (724), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (742) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (724), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (743) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (744) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (745) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (533), benzo

ル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(746)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(747)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(748)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(749)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(750)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0102]

(751)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(752)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(753)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (746) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (747) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (748) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (533), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substitution lower alkoxy group

As for (749) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (533), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (750) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

[0102]

As for (751) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (752) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (753) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (545), benzo

換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(754)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(755)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(756)G、X、R¹、R³及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²が基-(O)^m-A-(CO)^u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(757)G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(758)G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(759)G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(760)G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0103]

(761)G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (754) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (755) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (545), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substitution lower alkoxy group

As for (756) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (545), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O)^m-A-(CO)^u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (757) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (758) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (759) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (760) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

[0103]

As for (761) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (557), benzo

置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(762)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(557)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(763)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(557)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(764)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(569)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(765)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(569)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(766)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(569)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(767)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(569)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(768)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(569)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(769)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(569)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (762) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (557), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substitution lower alkoxy group

As for (763) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (557), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (764) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (765) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (766) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (767) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (768) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (769) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (569), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

テロ環誘導体又はその塩

(770)G、X、R¹、R³及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0104】

(771)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(772)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(773)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(774)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(775)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(776)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(777)G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is carboxy substitution lower alkoxy group

As for (770) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (569), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

[0104]

As for (771) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (772) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (773) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (774) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (775) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (776) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (581), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substitution lower alkoxy group

As for (777) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (581), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

(778) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(779) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(780) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0105】

(781) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(782) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(783) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(784) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(593)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(785) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(605)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体

u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (778) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (779) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (780) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

[0105]

As for (781) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (782) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (783) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (593), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substitution lower alkoxy group

As for (784) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (593), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO)

u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (785) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with

又はその塩

(786)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(787)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(788)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(789)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(790)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0106]

(791)G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(792)G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(793)G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (786) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (787) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (788) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (789) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (790) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substitution lower alkoxy group

[0106]

As for (791) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (605), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (792) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (793) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

(794) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(617)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(795) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(617)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(796) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(617)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(797) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(617)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(798) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(617)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m, u, A, R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(799) G が基(R²)(R³)-Xを示し、X が基=CH-を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がピリジル環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジンカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(800) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(799)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその

R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (794) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (795) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (796) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (797) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (617), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substitution lower alkoxy group

As for (798) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (617), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A-(CO) uNR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(799) G basis (R²)(R³) (R² shows basis =CH-, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition R¹ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).) showing, R with respect to pyridyl ring as substituent on phenyl ring thegroup which becomes phenyl group and pyridyl group which have times whenit possesses lower alkyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed withaforementioned General Formula (1) which is a pyridine carbonyl group which has times whenit possesses group which is chosen

As for (800) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with

塩。

【0107】

(801)G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(802)G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(803)G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(804)G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(805)G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(806)G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(807)G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(808)G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

【0107】

As for (801) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (802) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (803) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (804) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (805) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (806) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (799), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (807) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (799), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (808) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (799), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

(809)G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(810)G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0108]

(811)Gが基(R²)(R³)-Xを示し、Xが基=CH-を示し、R³が水素原子を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記[化5]で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(812)G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(813)G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(814)G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(815)G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(816)G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベン

As for (809) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (799), R² and R³ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (810) G, X, R¹ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substituted lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (799), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substituted lower alkylidene group

[0108]

(811) G basis (R²) (R³) -X shows -X-, X shows basis =CH-, R³ shows hydrogen atom, being same to definition R¹ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). R⁸ shows hydrogen atom.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (812) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (813) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (814) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (815) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (816) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (811), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula

ゾヘテロ環誘導体又はその塩

(817)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(811)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(818)G、X、 R^1 及び R は前記(811)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(819)G、X、 R^1 及び R は前記(811)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(820)G、X、 R^1 及び R は前記(811)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0109】

(821)G、X、 R^1 及び R は前記(811)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(822)G、X、 R^1 及び R は前記(811)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(823)G が基(R^2)(R^3)-X-を示し、X が基=CH-を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (817) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (818) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (811), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (819) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (811), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (820) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (811), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

【0109】

As for (821) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (811), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (822) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (811), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

(823) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-,being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group ,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which isa group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows lower alkyl group .) where R is

(824)G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(825)G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(826)G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(827)G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(828)G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(829)G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(830)G、X、R¹及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0110]

(831)G、X、R¹及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(832)G、X、R¹及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般

shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (824) G, X, R¹ and R³ being same to definition of aforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (825) G, X, R¹ and R³ being same to definition of aforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (826) G, X, R¹ and R³ being same to definition of aforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (827) G, X, R¹ and R³ being same to definition of aforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (828) G, X, R¹ and R³ being same to definition of aforementioned (823), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (829) G, X, R¹ and R³ being same to definition of aforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (830) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (823), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

[0110]

As for (831) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (823), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (832) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (823), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic

式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(833)G、X、 R^1 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(834)G、X、 R^1 及びRは前記(823)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(835)Gが基(R^2)(R^3)-Xを示し、Xが基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記[化5]で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(836)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(837)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(838)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(835)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(839)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(840)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(835)の定義に

derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (833) G, X, $R^{1</sup>1</sup> and R being same to definition of aforementioned (823), $R^{2</sup>2</sup> and $R^{3</sup>3</sup> becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (834) G, X, $R^{1</sup>1</sup> and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substituted lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (823), $R^{2</sup>2</sup> and $R^{3</sup>3</sup> becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group$$$$$$

(835) G basis ($R^{2</sup>2</sup> } ($R^{3</sup>3</sup> }) shows -X-, X shows basis =CH-, $R^{3</sup>3</sup> shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition $R^{1</sup>1</sup> in aforementioned General Formula (1), $R^{2</sup>2</sup> basis -NR⁴4</sup>R⁵5</sup> shows (As for $R^{4</sup>4</sup> and $R^{5</sup>5</sup> same to definition in the aforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{9</sup>9</sup> and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). $R^{8</sup>8</sup> shows hydroxy group .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)$$$$</sup></sup>$$$$$

As for (836) G, X, $R^{1</sup>1</sup>, $R^{3</sup>3</sup> and R being same to definition of aforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2</sup>2</sup> is hydrogen atom$$$

As for (837) G, X, $R^{1</sup>1</sup>, $R^{3</sup>3</sup> and R being same to definition of aforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2</sup>2</sup> is hydroxy group$$$

As for (838) G, X, $R^{1</sup>1</sup>, $R^{3</sup>3</sup> and R being same to definition of aforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2</sup>2</sup> is carboxy substituted lower alkyl group$$$

As for (839) G, X, $R^{1</sup>1</sup>, $R^{3</sup>3</sup> and R being same to definition of aforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{2</sup>2</sup> is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group$$$

As for (840) G, X, $R^{1</sup>1</sup>, $R^{3</sup>3</sup> and R$$

同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0111】

(841)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(842)G、X、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(843)G、X、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(844)G、X、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(845)G、X、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(846)G、X、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(847)G が基(R^2)(R^3)-X-を示し、X が基=CH-を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記〔化5〕で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

being same to definition ofaforementioned (835), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

[0111]

As for (841) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (842) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (843) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (844) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (845) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (846) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (835), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(847) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-,being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵($R^{⁴}$ $R^{⁵}$) shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group ,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which isa group (As for $R^{⁹}$ and p

(848)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(847)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(849)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(847)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(850)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(847)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0112】

(851)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(847)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(852)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(847)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(853)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(847)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(854)G, X, R¹ 及び R は前記(847)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(855)G, X, R¹ 及び R は前記(847)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

same to definition in theaforementioned General Formula (1). R^⁸ shows nitro group .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (848) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is hydrogen atom

As for (849) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is hydroxy group

As for (850) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is carboxy substituted lower alkyl group

【0112】

As for (851) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (852) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (847), R^² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (853) G, X, R^¹, R^³ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R^² is lower alkanoyl group

As for (854) G, X, R^¹ and R being same to definition ofaforementioned (847), R^² and R^³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (855) G, X, R^¹ and R being same to definition ofaforementioned (847), R^² and R^³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

(856)G、X、 R^1 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(857)G、X、 R^1 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(858)G、X、 R^1 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(859)G が基(R^2)(R^3)-Xを示し、X が基=CHを示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(860)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0113]

(861)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(862)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(863)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わ

As for (856) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (857) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (858) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (847), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(859) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).),benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which isa group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows halogen atom .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (860) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

[0113]

As for (861) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (862) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (863) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with

されるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(864)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(865)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(866)G、X、 R^1 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(867)G、X、 R^1 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(868)G、X、 R^1 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(869)G、X、 R^1 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(870)G、X、 R^1 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0114]

(871)G が基(R^2)(R^3)-Xを示し、X が基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記[化 5]で示される基(R^9 及び p は前記一般式

theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (864) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (865) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (866) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (867) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (868) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (869) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (870) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (859), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

[0114]

(871) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for

(1)における定義に同じ。R⁸は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(872)G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(873)G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(874)G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(875)G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(876)G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(877)G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(878)G、X、R¹及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(879)G、X、R¹及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベ

R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).),benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which isa group (As for R⁹ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). R⁸ shows lower alkoxy group .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (872) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (873) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (874) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (875) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (876) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (877) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (878) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (871), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (879) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (871), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic

ンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(880)G、X、 R^1 及び R は前記(871)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0115】

(881)G、X、 R^1 及び R は前記(871)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(882)G、X、 R^1 及び R は前記(871)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(883)G が基(R^2)(R^3)-Xを示し、X が基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が 9-オキソフルオレンル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(884)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(885)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(886)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(887)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わ

derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (880) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (871), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

[0115]

As for (881) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (871), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (882) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (871), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(883) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ (R^4 and R^5 same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the R 9-oxo fluorenyl group is

As for (884) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (885) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (886) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (887) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with

されるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(888)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(889)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(890)G、X、 R^1 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0116】

(891)G、X、 R^1 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(892)G、X、 R^1 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(893)G、X、 R^1 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(894)G、X、 R^1 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(895)G が基(R^2)(R^3)-X-を示し、X が基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R が前記【化 5】で示される基(R^9 及び p は前記一般式

theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (888) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (883), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (889) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (890) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (883), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

【0116】

As for (891) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (883), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (892) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (883), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (893) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (883), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (894) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (883), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(895) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for

(1)における定義に同じ。R⁸は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(896)G、X、R¹、R³及びRは前記(895)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(897)G、X、R¹、R³及びRは前記(895)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(898)G、X、R¹、R³及びRは前記(895)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(899)G、X、R¹、R³及びRは前記(895)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(900)G、X、R¹、R³及びRは前記(895)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0117]

(901)G、X、R¹、R³及びRは前記(895)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(902)G、X、R¹及びRは前記(895)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).),benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which isa group (As for R⁹ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). R⁸ shows amino group which has fact that it possesses the lower alkanoyl group as substituent .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (896) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (897) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (898) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (899) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (900) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (895), R² benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

[0117]

As for (901) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (902) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (895), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

(903) G, X, R^1 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(904) G, X, R^1 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(905) G, X, R^1 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(906) G, X, R^1 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(907) G, X, R^1 , R^3 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(908) G, X, R^1 , R^3 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(909) G, X, R^1 , R^3 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(910) G, X, R^1 , R^3 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0118]

(911) G, X, R^1 , R^3 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

As for (903) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (895), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (904) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (895), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (905) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (895), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (906) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (895), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (907) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (908) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (909) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (910) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

[0118]

As for (911) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where

表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(912)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(913)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(914)G が基(R^2)(R^3)-X-を示し、X が基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(915)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(916)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(917)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(918)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(919)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基

$R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (912) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (895), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (913) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (895), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

(914) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a quinolyl carbonyl group which has times when the $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), R on quinoline ring possesses the phenyl group as substituent

As for (915) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (916) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (917) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (918) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (919) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (914),

を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(920)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0119]

(921)G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(922)G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(923)G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(924)G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(925)G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(926)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(927)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

$R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (920) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

[0119]

As for (921) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (922) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (923) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (924) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (925) G, X, $R^{¹}$ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (914), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (926) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (927) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

(928)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(929)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(930)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0120]

(931)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(932)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(933)Gが基(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(934)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(933)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(935)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(933)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で

As for (928) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (929) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (930) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

[0120]

As for (931) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (932) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (914), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷(As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(933) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).),benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where R is adamantyl carbonyl group

As for (934) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (935) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (933), benzo

表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(936) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(933)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(937) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(933)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(938) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(933)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(939) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(933)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(940) G, X, R¹ 及び R は前記(933)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0121]

(941) G, X, R¹ 及び R は前記(933)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(942) G, X, R¹ 及び R は前記(933)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(943) G, X, R¹ 及び R は前記(933)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(944) G, X, R¹ 及び R は前記(9

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (936) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (937) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (938) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (933), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (939) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (940) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (933), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt, which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

[0121]

As for (941) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (933), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (942) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (933), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (943) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (933), R² and R³ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (944) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General

33)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(945)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(933)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(946)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(933)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(947)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(933)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(948)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(933)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(949)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(933)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(950)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(933)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0122】

(951)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(933)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (933), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (945) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (946) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (947) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (948) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (949) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (950) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (933), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

【0122】

As for (951) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (933), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

(952)Gが基(R²)(R³)-Xを示し、Xが基=CH-を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(953)G、X、R¹、R³及びRは前記(952)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(954)G、X、R¹、R³及びRは前記(952)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(955)G、X、R¹、R³及びRは前記(952)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(956)G、X、R¹、R³及びRは前記(952)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(957)G、X、R¹、R³及びRは前記(952)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(958)G、X、R¹、R³及びRは前記(952)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(959)G、X、R¹及びRは前記(952)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(952) G basis (R²) (R³) shows -X-, X shows basis =CH-, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition R¹ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a thienyl carbonyl group which has times when the R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), R on thiophene ring possesses the phenyl group as substituent

As for (953) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (954) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (955) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (956) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (957) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (952), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is an amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (958) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (959) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (952), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

(960)G, X, R¹ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0123】

(961)G, X, R¹ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(962)G, X, R¹ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(963)G, X, R¹ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(964)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(965)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(966)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(967)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(968)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(952)の定義に同じであり、R² が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

As for (960) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (952), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

【0123】

As for (961) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (952), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (962) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (952), R² and R³ becoming simultaneous,as for benzo heterocyclic derivative or its salt (963) G, X, R¹ and R which are displayed with theaforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group beingsame to definition of aforementioned (952), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isdisplayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (964) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (965) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (966) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (967) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (968) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(969)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(970)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0124】

(971)Gが基(R^2)(R^3)-Xを示し、Xが基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(972)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(973)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(974)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(971)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(975)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (969) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (952), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (970) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (952), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

【0124】

(971) G basis (R²) (R³) shows -X-, X shows basis =CH-, R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, being same to definition R¹ in aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).) showing, R on thiazole ring as for benzo heterocyclic derivative or its salt (972) G, X, R¹, R³ and R which are displayed with aforementioned General Formula (1) which is a thiazolyl carbonyl group which has times when it possesses phenyl group as substituent being same to definition of aforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where R² is the hydrogen atom

As for (973) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (974) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (975) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

(976)G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(977)G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(978)G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(979)G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(980)G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0125]

(981)G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(982)G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(983)G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(984)G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基で

As for (976) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (971), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (977) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (978) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (971), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (979) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (971), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (980) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (971), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

[0125]

As for (981) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (971), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (982) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (971), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (983) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (984) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (971), benzo

ある前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(985)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(971)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(986)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(987)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(988)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(971)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(989)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(990)Gが基(R^2)(R^3)-Xを示し、Xが基=CHを示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0126】

(991)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (985) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (986) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (987) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (988) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (971), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (989) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (971), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(990) G basis ($R^{²}$) ($R^{³}$) shows -X-, X shows basis =CH-, $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).),benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) where R is cycloalkyl carbonyl group

【0126】

As for (991) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

(992)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(993)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(994)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(995)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(996)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(997)G, X, R¹ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(998)G, X, R¹ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(999)G, X, R¹ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1000)G, X, R¹ 及び R は前記(990)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成す

R² is hydrogen atom

As for (992) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (993) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (994) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (995) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (990), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (996) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (997) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (990), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (998) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (990), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (999) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (990), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1000) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (990), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic

る前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0127】

(1001)G、X、R¹及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1002)G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1003)G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1004)G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1005)G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1006)G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1007)G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1008)G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

derivative or its salt, which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

[0127]

As for (1001) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (990), R² and R³ becoming simultaneous, as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1002) G, X, R¹, R³ and R which are displayed with the aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group being same to definition of aforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where R² is the lower alkoxy group

As for (1003) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1004) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1005) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1006) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1007) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (990), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1008) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (990), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A,

(1009)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(799)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1010)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(799)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0128】

(1011)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(799)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1012)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(799)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1013)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(799)の定義に同じであり、R² が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1014)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(799)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1015)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(799)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m, u, A, R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1016)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(811)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1009) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1010) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

[0128].

As for (1011) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1012) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1013) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1014) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1015) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (799), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1016) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

(1017)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(811)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1018)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(811)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1019)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(811)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1020)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(811)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0129]

(1021)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(811)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1022)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(811)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1023)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(823)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1024)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(823)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is lower alkoxy group

As for (1017) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1018) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1019) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1020) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

[0129]

As for (1021) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (811), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1022) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (811), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1023) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1024) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

(1025)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(823)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1026)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(823)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1027)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(823)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1028)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(823)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1029)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(823)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1030)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0130]

(1031)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1032)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

As for (1025) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1026) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1027) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1028) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (823), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1029) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (823), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1030) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

[0130]

As for (1031) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (1032) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

(1033)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1034)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1035)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1036)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1037)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1038)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1039)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1040)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

As for (1033) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1034) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1035) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1036) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (835), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1037) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (1038) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (1039) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1040) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

【0131】

【0131】

(1041)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1042)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1043)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1044)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1045)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1046)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1047)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1048)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1049)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(859)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アル

As for (1041) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1042) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1043) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (847), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1044) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (1045) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (1046) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1047) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1048) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1049) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (859), benzo

コキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1050)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(859)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0132]

(1051)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(871)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1052)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(871)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1053)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(871)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1054)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(871)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1055)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(871)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1056)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(871)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1057)G、X、R¹、R³ 及び R は前記(871)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1050) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (859), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

[0132]

As for (1051) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1052) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1053) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1054) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1055) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1056) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1057) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (871), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its

定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1058)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1059)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1060)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0133】

(1061)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1062)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1063)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1064)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1065)G が基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Y が基-NR⁴-

salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R^6 and R^7 same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

As for (1058) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is lower alkoxy group

As for (1059) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is cyano substituted lower alkyl group

As for (1060) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

【0133】

As for (1061) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1062) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1063) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (883), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R^2 is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1064) G, X, R^1 , R^3 and R being same to definition of aforementioned (883), R^2 basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R^6 and R^7 same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

(1065) G to show basis -Y-C(R^2)(R^3)-

(R⁴は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rがピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1066)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1067)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1068)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1069)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1070)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0134】

(1071)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(R³) -, Y basis -NR^A - to show (As for R^A same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition R¹ in the aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ to show (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the R³ hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group showing, R on pyridine ring as substituent on phenyl ring group which becomes phenyl group and pyridyl group which have times when it possesses lower alkyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a pyridyl carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen

As for (1066) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (1067) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1065), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1068) G, X, R¹, R³ and R which are displayed with aforementioned General Formula (1) where R² is the hydroxy group being same to definition of aforementioned (1065), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1069) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1070) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1065), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is an amino substituted lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

【0134】

As for (1071) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

(1072)G、X、R¹及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1073)G、X、R¹及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1074)G、X、R¹及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1075)G、X、R¹及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1076)G、X、R¹及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1077)Gが基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Yが基-NR^A-(R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1078)G、X、R¹、R³及びRは前記(1077)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1079)G、X、R¹、R³及びRは前記(1077)の定義

As for (1072) G, X, R¹ and R being same to definition of aforesaid (1065), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms oxo group

As for (1073) G, X, R¹ and R being same to definition of aforesaid (1065), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (1074) G, X, R¹ and R being same to definition of aforesaid (1065), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1075) G, X, R¹ and R being same to definition of aforesaid (1065), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1076) G, X, R¹ and R being same to definition of aforesaid (1065), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(1077) G shows basis -Y-C (R²)(R³) - (R² and R³ being same to definition of aforesaid (1065), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1).), being same to definition of aforesaid (1065), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1).), the R² shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p being same to definition in the aforesaid General Formula (1).), where R is shown with aforesaid (Chemical Formula 5)

As for (1078) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (1079) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforesaid (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1) where

に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(1080)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0135】

(1081)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1082)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1083)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1084)G、X、 R^1 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1085)G、X、 R^1 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1086)G、X、 R^1 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1087)G、X、 R^1 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

being same to definition ofaforementioned (1077), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1080) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R whichare displayed with aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is the hydroxy group being same to definition ofaforementioned (1077), the benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

【0135】

As for (1081) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1082) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1083) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (1084) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (1085) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (1086) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1087) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl

導体又はその塩

(1088)G、X、 R^1 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1089)G が基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Y が基-NR^A-(R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記〔化 5〕で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1090)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0136】

(1091)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1092)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1093)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1094)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

substitution lower alkylidene group

As for (1088) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (1077), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(1089) G shows basis -Y-C ($R^{²}$) ($R^{³}$) -, Y basis -NR^A- shows (As for $R^{^A}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows lower alkyl group.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (1090) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

【0136】

As for (1091) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (1092) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1093) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1094) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1089), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group

ベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1095)G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1096)G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1097)G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1098)G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1099)G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1100)G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0137]

(1101)Gが基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Yが基-NR^A-(R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記[化5]で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1095) G, X, R¹ and R³ and R being same to definition of aforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (1096) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1089), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (1097) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1089), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (1098) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1089), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1099) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1089), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1100) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1089), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

[0137]

(1101) G shows basis -Y-C(R²)(R³)- (R² and R³ basis -NR^A-(R^A shows (As for R^A same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition R¹ in the aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵(R⁴ and R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1).

(1102)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1103)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1104)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1105)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1106)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1107)G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1108)G, X, R¹ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1109)G, X, R¹ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1110)G, X, R¹ 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はそ

R⁸ shows hydroxy group .) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (1102) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (1103) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1101), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1104) G, X, R¹, R³ and R which are displayed with aforementioned General Formula (1) where R² is the hydroxy group being same to definition of aforementioned (1101), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1105) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1106) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1101), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1107) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (1108) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1101), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (1109) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1101), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (1110) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1101), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned

の塩。

【0138】

(1111)G、X、 R^1 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1112)G、X、 R^1 及び R は前記(1101)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1113)G が基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Y が基-NR^A- (R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記〔化5〕で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1114)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1113)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1115)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1113)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1116)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1113)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1117)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1113)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

【0138】

As for (1111) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (1101), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1112) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (1101), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(1113) G shows basis -Y-C ($R^{²}$) ($R^{³}$) -, Y basis -NR^A- shows (As for $R^{^A}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition $R^{¹}$ in the aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ ($R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in the aforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows nitro group.) where R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (1114) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (1115) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1113), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1116) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R which are displayed with aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is the hydroxy group being same to definition of aforementioned (1113), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1117) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower

(1118)G、X、R¹、R³及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1119)G、X、R¹、R³及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1120)G、X、R¹及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0139]

(1121)G、X、R¹及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1122)G、X、R¹及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1123)G、X、R¹及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1124)G、X、R¹及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1125)Gが基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Yが基-NR^A-(R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又

R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1118) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1113), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1119) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (1120) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1113), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

[0139]

As for (1121) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1113), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (1122) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1113), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1123) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1113), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1124) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1113), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

(1125) G shows basis -Y-C (R²) (R³) - (R² ³ </sup>), Y basis -NR^A- shows(As for R^A same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition R¹ in theaforementioned General Formula (1),

は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記〔化 5〕で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1126)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1127)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1128)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1129)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1130)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0140】

(1131)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1132)G、X、 R^1 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

$R^{²}$ basis - $NR^{⁴}$ $R^{⁵}$ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows halogen atom .) where R is shownwith aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (1126) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (1127) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1128) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R whichare displayed with aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is the hydroxy group being same to definition of aforementioned (1125), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1129) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1130) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

【0140】

As for (1131) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (1132) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

(1133) G, X, R¹ 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1134) G, X, R¹ 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1135) G, X, R¹ 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1136) G, X, R¹ 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、R² と R³ が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1137) G が基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Y が基-NR^A-(R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴ 及び R⁵ は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記[化 5]で示される基(R⁹ 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸ は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1138) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1139) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1140) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

As for (1133) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1125), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (1134) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1125), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1135) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1125), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1136) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1125), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

(1137) G shows basis -Y-C (R²) (R³) - , Y basis -NR^A-(R^A shows (As for R^A same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition R¹ in theaforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for R⁹ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). R⁸ shows lower alkoxy group .) where R is shownwith aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (1138) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1137), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (1139) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1137), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1140) G, X, R¹, R³ and R whichare displayed with aforementioned General Formula (1) where R² is the hydroxy group being same to definition of aforementioned (1137), the benzo heterocyclic derivative

ヘテロ環誘導体又はその塩。

【0141】

(1141)G、X、R¹、R²及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1142)G、X、R¹、R²及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1143)G、X、R¹、R²及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1144)G、X、R¹及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1145)G、X、R¹及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1146)G、X、R¹及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1147)G、X、R¹及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1148)G、X、R¹及びRは前記(1137)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the R² is carboxy substituted lower alkyl group

【0141】

As for (1141) G, X, R¹, R² and R being same to definition of aforementioned (1137), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1142) G, X, R¹, R² and R being same to definition of aforementioned (1137), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1143) G, X, R¹, R² and R being same to definition of aforementioned (1137), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (1144) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1137), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (1145) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1137), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (1146) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1137), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1147) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1137), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1148) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1137), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower

(1149)G が基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Y が基-NR^A- (R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が9-オキソフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1150)G、X、R¹、R³及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0142]

(1151)G、X、R¹、R³及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1152)G、X、R¹、R³及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1153)G、X、R¹、R³及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1154)G、X、R¹、R³及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1155)G、X、R¹、R³及びRは前記(1149)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

(1149) G shows basis -Y-C (R²) (R³) - (R² ³), Y basis -NR^A - shows (As for R^A same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition R¹ in the aforementioned General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ (R⁴ ⁴ and R⁵ ⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in the aforementioned General Formula (1).), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, R 9-oxo fluorenyl group is

As for (1150) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt, which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

[0142]

As for (1151) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is hydroxy group

As for (1152) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1153) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1154) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1149), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1155) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

(1156)G、X、 R^1 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1157)G、X、 R^1 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1158)G、X、 R^1 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1159)G、X、 R^1 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1160)G、X、 R^1 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0143]

(1161)G が基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Y が基-NR^A- (R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR^AR⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R が前記〔化5〕で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1162)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

As for (1156) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1149), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (1157) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1149), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (1158) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1149), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1159) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1149), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1160) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1149), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt, which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

[0143]

(1161) G shows basis -Y-C ($R^{²}$) ($R^{³}$) -, Y basis -NR^A- shows (As for $R^{^A}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), being same to definition $R^{¹}$ in theaforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR^AR⁵(R^4 and R^5 shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), the $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a group (As for $R^{⁹}$ and p same to definition in theaforementioned General Formula (1). $R^{⁸}$ shows amino group which has fact that it possesses the lower alkanoyl group as substituent.) where R is shownwith aforementioned (Chemical Formula 5)

As for (1162) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

(1163)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1164)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1165)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1166)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1167)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1168)G、X、R¹及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1169)G、X、R¹及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1170)G、X、R¹及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0144]

(1171)G、X、R¹及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキ

R² is hydrogen atom

As for (1163) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1161), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1164) G, X, R¹, R³ and R which are displayed with aforementioned General Formula (1) where R² is the hydroxy group being same to definition of aforementioned (1161), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1165) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1166) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1161), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1167) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (1168) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1161), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms oxo group

As for (1169) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1161), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (1170) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1161), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

[0144]

As for (1171) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1161), R² and

シカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1172)G、X、R¹及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1173)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1174)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1175)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1176)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1177)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1178)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1179)G、X、R¹、R³及びRは前記(1161)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1172) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1161), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (1173) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1174) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1175) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1176) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1177) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1178) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1161), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1179) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1161), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A,

(1180)G が基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Y が基-NR^A- (R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³ が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹ が前記一般式(1)における定義に同じであり、R² が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0145]

(1181)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1182)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1183)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1184)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1185)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1186)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(1180) G shows basis -Y-C (R²) - , Y basis -NR^A- shows (As for R³ same to definition in aforementioned General Formula (1).), R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition R¹ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a quinolyl carbonyl group which has timeswhen R² basis -NR⁴R⁵ shows (As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), R on quinoline ring possesses phenyl group as substituent

[0145]

As for (1181) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is hydrogen atom

As for (1182) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1183) G, X, R¹, R³ and R whichare displayed with aforementioned General Formula (1) where R² is the hydroxy group being same to definition of aforementioned (1180), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1184) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1185) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1186) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

(1187)G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1188)G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1189)G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1190)G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0146】

(1191)G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1192)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1193)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1194)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1195)G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表

As for (1187) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1180), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (1188) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1180), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (1189) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1180), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1190) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1180), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

【0146】

As for (1191) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1180), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (1192) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1193) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1194) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1195) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with

わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1196)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1180)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1197)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1180)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1198)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1180)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1199)G が基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Y が基-NR^A-(R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1200)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0147]

(1201)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1202)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1196) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1197) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1180), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1198) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1180), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(1199) G shows basis -Y-C ($R^{²}$) ($R^{³}$) -, Y basis -NR^A- shows(As for $R^{^A}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows(As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1)where R is adamantyl carbonyl group

As for (1200) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

[0147]

As for (1201) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

As for (1202) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

ヘテロ環誘導体又はその塩

(1203)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1204)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1205)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1206)G、X、R¹及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1207)G、X、R¹及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1208)G、X、R¹及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1209)G、X、R¹及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1210)G、X、R¹及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0148】

R² is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1203) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1204) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1199), R² benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1205) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl group

As for (1206) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1199), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (1207) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1199), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (1208) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1199), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1209) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1199), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1210) G, X, R¹ and R being same to definition ofaforementioned (1199), R² and R³ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

【0148】

(1211)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1212)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1213)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1214)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1215)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1216)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1217)G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1218)Gが基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Yが基-NR⁴-(R⁴は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一

As for (1211) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1212) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1213) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1214) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1215) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1216) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (1199), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1217) G, X, R¹ and R³ being same to definition ofaforementioned (1199), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(1218) G shows basis -Y-C (R²) (R³) - (R⁴ basis -NR⁴ - shows(As for R⁴ same to definition in aforementioned General Formula (1).), R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition R¹ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a

般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1219)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1220)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0149]

(1221)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1222)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1223)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1224)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1225)G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1226)G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

thienyl carbonyl group which has timeswhen $R^{²}$ basis -NR⁴R⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), R on thiophene ring possesses phenyl group as substituent

As for (1219) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (1220) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydroxy group

[0149]

As for (1221) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1222) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1223) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1224) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (1225) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (1226) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

(1227)G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1228)G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1229)G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1230)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0150]

(1231)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1232)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1233)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1234)G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

General Formula (1) which forms lower alkylidene group

As for (1227) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (1218), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1228) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (1218), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1229) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition of aforementioned (1218), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (1230) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

[0150]

As for (1231) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (1232) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1233) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1234) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

(1235)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1236)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1237)G が基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Y が基-NR^A- (R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R がチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1238)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1239)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1240)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0151】

(1241)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1242)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1237)の定義

As for (1235) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1236) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1218), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwithaforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR^⁶R^⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(1237) G shows basis -Y-C ($R^{²}$) ($R^{³}$) -, Y basis -NR^{^A}- shows(As for $R^{^A}$ same to definition in aforementioned General Formula (1).), $R^{³}$ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition $R^{¹}$ in aforementioned General Formula (1), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwithaforementioned General Formula (1) which is a thiazolyl carbonyl group which has timeswhen $R^{²}$ basis -NR^⁴R^⁵ shows (As for $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), R on thiazole ring possesses phenyl group as substituent

As for (1238) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is hydrogen atom

As for (1239) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1240) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R whichare displayed with aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is the hydroxy group being same to definition of aforementioned (1237), the benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

【0151】

As for (1241) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

As for (1242) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R

に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1243)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1244)G、X、 R^1 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1245)G、X、 R^1 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1246)G、X、 R^1 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1247)G、X、 R^1 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1248)G、X、 R^1 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1249)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1250)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

being same to definition ofaforementioned (1237), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1243) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (1244) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (1245) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (1246) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1247) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1248) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (1249) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (1250) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

【0152】

(1251)G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1252)G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1253)G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1254)G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1255)G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1256)Gが基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Yが基-NR^A-(R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1257)G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is cyano substituted lower alkyl group

【0152】

As for (1251) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1252) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1253) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1254) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1237), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1255) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1237), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforesaid General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

(1256) G shows basis -Y-C (R²) (R³) - (R³ shows (R³ basis -NR^A- shows(As for R^A same to definition in aforesaid General Formula (1).), R³ shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group , being same to definition R¹ in aforesaid General Formula (1), R² basis -NR⁴R⁵ shows(As for R⁴ and R⁵ same to definition in theaforementioned General Formula (1).), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforesaid General Formula (1)where R is cycloalkyl carbonyl group

As for (1257) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

塩

(1258)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1259)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1260)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0153】

(1261)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1262)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1263)G、X、 R^1 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1264)G、X、 R^1 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1265)G、X、 R^1 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1266)G、X、 R^1 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキ

$R^{²}$ is hydrogen atom

As for (1258) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1256), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1259) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R whichare displayed with aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is the hydroxy group being same to definition ofaforementioned (1256), the benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) where the $R^{²}$ is carboxy substituted lower alkyl group

As for (1260) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group

【0153】

As for (1261) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1256), $R^{²}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) which is a amino substitution lower alkanoyl oxy group which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent

As for (1262) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl group

As for (1263) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1256), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms oxo group

As for (1264) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1256), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkylidene group

As for (1265) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1256), $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous,benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) whichforms lower alkoxy-substituted lower alkylidene group

As for (1266) G, X, $R^{¹}$ and R being same to definition ofaforementioned (1256), $R^{²}$ and

シカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1267)G、X、 R^1 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1268)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1269)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1270)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0154】

(1271)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1272)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1273)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1274)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1256)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされ

R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group

As for (1267) G, X, R¹ and R being same to definition of aforementioned (1256), R² and R³ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which forms phenyl substitution lower alkylidene group

As for (1268) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1269) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1270) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

【0154】

As for (1271) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1272) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1273) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1256), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1274) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1256), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula

るベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1275)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1276)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1277)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1278)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1279)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1280)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0155】

(1281)G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1282)G、X、R¹、R³及びRは前記(1077)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前

(1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1275) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1276) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1277) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1278) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1279) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1280) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1065), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

【0155】

As for (1281) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1065), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1282) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1077), benzo

記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1283)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1284)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1285)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1286)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1287)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1288)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1289)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1290)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (1283) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (1284) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1285) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1286) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1287) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1288) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1077), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1289) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (1290) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

【0156】

(1291)G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1292)G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1293)G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1294)G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1295)G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1296)G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1297)G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1298)G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is cyano substituted lower alkyl group

【0156】

As for (1291) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1292) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1293) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1294) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1089), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1295) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1089), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1296) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1297) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1298) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl

(1299)G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1300)G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0157]

(1301)G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0158]

(1302)G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1303)G、X、R¹、R³及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1304)G、X、R¹、R³及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1305)G、X、R¹、R³及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1306)G、X、R¹、R³及びRは前記(1113)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

group

As for (1299) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1300) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

[0157]

As for (1301) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1101), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

[0158]

As for (1302) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1101), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1303) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1304) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1305) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1306) G, X, R¹, R³ and R being same to definition ofaforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1307)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1113)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1308)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1113)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1309)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1113)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1310)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0159]

(1311)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1312)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1313)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1314)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

$R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1307) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

$R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1308) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1113), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

$R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1309) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1113), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayedwith aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO)

u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

As for (1310) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

$R^{²}$ is lower alkoxy group

[0159]

As for (1311) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

$R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (1312) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

$R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1313) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

$R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

As for (1314) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition ofaforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with theaforementioned General Formula (1) where

$R^{²}$ is lower alkoxy carbonyl group substitution

(1315) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1316) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1125)の定義に同じであり、R² が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m, u, A, R⁶ 及び R⁷ は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1317) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1318) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1319) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1320) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0160】

(1321) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1322) G, X, R¹, R³ 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、R² がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R² is lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group

As for (1315) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1125), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1316) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1125), R² basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, R⁶ and R⁷ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

As for (1317) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1137), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkoxy group

As for (1318) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1137), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is cyano substituted lower alkyl group

As for (1319) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1137), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1320) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1137), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

【0160】

As for (1321) G, X, R¹, R³ and R being same to definition of aforementioned (1137), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1322) G, X, R¹, R³ and R which are displayed with aforementioned General Formula (1) where R² is the lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group being same to definition of the aforementioned (1137), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where R² is carboxyl substitution

(1323)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1324)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1325)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1326)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1327)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0161]

(1328)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(1329)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1330)G、X、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

lower alkoxy group

As for (1323) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1137), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ same to definition in the aforementioned General Formula (1).)

As for (1324) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkoxy group

As for (1325) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is cyano substituted lower alkyl group

As for (1326) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is tetrazolyl group substituted lower alkyl group

As for (1327) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group

[0161]

As for (1328) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1149), as for benzo heterocyclic derivative or its salt (1329) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R which are displayed with aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is the lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group being same to definition of the aforementioned (1149), benzo heterocyclic derivative or its salt which is displayed with the aforementioned General Formula (1) where $R^{²}$ is carboxyl substitution lower alkoxy group

As for (1330) G, X, $R^{¹}$, $R^{³}$ and R being same to definition of aforementioned (1149), $R^{²}$ basis - benzo heterocyclic derivative or its salt . which is displayed with aforementioned General Formula (1) which is a (O) m-A- (CO) u-NR⁶R⁷ (As for m, u, A,

【0162】

(1331)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X がメチレン基である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0163】

(1332)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が単結合である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1333)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が基=CH-である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1334)G が基-C(R²)(R³)-Xを示し、X が基-NR¹⁴-である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1335)G が基-Y-C(R²)(R³)-である請求項 1 記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1336)R が、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1331)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1337)R が前記[化 5]で示される基である前記(1331)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(1338)R が、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1332)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

R⁶ and R⁷ same to definition in theaforementioned General Formula (1).)

【0162】

(1331) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, benzo heterocyclic derivative or its salt . which is stated in Claim 1 where X is methylene group

【0163】

(1332) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in Claim 1 where X is single bond

benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in Claim 1 where (1333) G basis -C (R²) (R³) -X shows -X-, X basis =CH-

benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in Claim 1 where (1334) G basis -C (R²) (R³) -NR¹⁴- shows -X-, X basis -NR¹⁴- is

(1335) G basis -Y-C (R²) (R³) - shows -X-, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in the Claim 1 which is

(1336) R, On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Group which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has timeswhen it possesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which hastimes when it possesses phenyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforesaid (1331) which is a thiazolyl carbonyl group or a cycloalkyl carbonyl group which hastimes when it possesses phenyl group as substituent

benzo heterocyclic derivative or its salt (1338) R which is stated in aforesaid (1331) which is a group where (1337) R is shown with aforesaid (Chemical Formula 5), On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Group which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has timeswhen it possesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which hastimes when it possesses phenyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforesaid (1332) which is a thiazolyl carbonyl group or a cycloalkyl carbonyl group which hastimes when it possesses phenyl group as substituent

(1339)R が前記[化 5]で示される基である前記(1332)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(1340)R が、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1333)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1341)R が前記[化 5]で示される基である前記(1333)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0164]

(1342)R が、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1334)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1343)R が前記[化 5]で示される基である前記(1334)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(1344)R が、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1335)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1345)R が前記[化 5]で示される基である前記

benzo heterocyclic derivative or its salt (1340) R which is stated in aforementioned (1332) which is a group where (1339) R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5), On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Group which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has timeswhen it possesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which hastimes when it possesses phenyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1333) which is a thiazolyl carbonyl group or a cycloalkyl carbonyl group which hastimes when it possesses phenyl group as substituent

benzo heterocyclic derivative or its salt . which is stated in aforementioned (1333) which is a group where (1341) R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5)

[0164]

(1342) R, On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Group which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has timeswhen it possesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which hastimes when it possesses phenyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1334) which is a thiazolyl carbonyl group or a cycloalkyl carbonyl group which hastimes when it possesses phenyl group as substituent

benzo heterocyclic derivative or its salt (1344) R which is stated in aforementioned (1334) which is a group where (1343) R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5), On pyridine ring as substituent on phenyl ring phenyl group which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent and Group which becomes pyridyl group on pyridyl carbonyl group ;9-oxo fluorenyl group ;quinoline ring which has timeswhen it possesses group which is chosen on quinolyl carbonyl group ;adamantyl carbonyl group ;thiophene ring which has thetimes when it possesses phenyl group as substituent on thienyl carbonyl group ;thiazole ring which hastimes when it possesses phenyl group as substituent benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1335) which is a thiazolyl carbonyl group or a cycloalkyl carbonyl group which hastimes when it possesses phenyl group as substituent

benzo heterocyclic derivative or its salt (1346)

(1335)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩(1346) R^9 が基-NR¹⁰R¹¹である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1347) R^9 がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1348) R^9 が窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する飽和もしくは不飽和の5~11員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有していてもよい)である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1349) R^9 が水素原子;低級アルカノイルオキシ基;低級アルカノイル基;低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基;低級アルキル基;低級アルキルチオ基;フェノキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基;ピ

$R^{⁹}$ which is stated in aforementioned (1335) which is a group where (1345) R is shown with aforementioned (Chemical Formula 5) basis-NR¹⁰R¹¹ benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1337) which is

(1347) $R^{⁹}$ on cycloalkyl group or phenyl ring on phenyl lower alkanoyl group ;phenyl ring which has factthat it possesses lower alkyl group as substituent as substituent is phenyl group which has times when it possesses group which is chosen fromgroup which becomes amino substitution .lower alkoxy group which has thetimes when it possesses lower alkyl group as amino group , phenyl group and substituent whichhave times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group , lower alkoxy group , phenyl lower alkoxy group , hydroxy group , lower alkanoyl oxy group , halogen atom substitution lower alkoxy group , nitro group , substituent description above benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in (1337)

benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1337) which is a monocycle of 5 - 11 member rings of saturated or unsaturated where (1348) $R^{⁹}$ 1 - 4 has the nitrogen atom , oxygen atom or sulfur atom or a heterocyclic group (As substituent becomes lower alkyl group , phenyl group , lower alkanoyl group , halogen atom , phenyl lower alkyl group and oxo group 1 - 3 it is possible to said heterocyclic group to have possessed group which is chosen from groupwhich) of binary ring

(1349) $R^{⁹}$ on hydrogen atom ;lower alkanoyl oxy group ;lower alkanoyl group ;lower alkoxy group ;phenyl ring on benzoyl group ;lower alkyl group ;lower alkyl thio group ;phenoxy group ;phenyl ring which has times when itpossesses lower alkyl group as substituent on phenoxy lower alkyl group ;phenyl ring which has times whenit possesses lower alkyl group as substituent on phenyl lower alkyl group ;phenyl ring which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent on anilino lower alkyl group ;phenyl ring which has thetimes when it possesses lower alkyl group as substituent as halogen atom , lower alkoxy carbonyl group and the substituent as substituent lower alkyl group and From group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when itpossesses lower alkyl group as substituent from group which becomes the amino carbonyl group which has times when it possesses group which is chosenon phenyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on benzoyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent on phenyl lower alkenyl group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent as substituent lower alkyl group it possesses amino sulfonyloxy

ロリジニル置換低級アルコキシ基;シクロアルケニル基;フェニル低級アルキルアミノカルボニル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基;シアノ基;又は基-(A)m-CHR¹²R¹³(A は前記に同じ。R¹² は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。m は 0 又は 1 を示す。)である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1350)R⁹ が基-NR¹⁰R¹¹である前記(1343)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1351)R⁹ がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記(1343)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0165]

(1352)R⁹ が窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1-4 個有する飽和もしくは不飽和の 5-11 員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を 1-3 個有していてもよい)である前記(1343)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1353)R⁹ が水素原子;低級アルカノイルオキシ基;低級アルカノイル基;低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基;低級アルキル基;低級アルキルチオ基;フェノキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのある

group ;cyano group ; or basis which has times when it possesses lower alkyl group as benzoyl lower alkyl group ;pyrrolidinyl substitution lower alkoxy group ;cycloalkenyl group ;phenyl lower alkyl amino carbonyl group ;substituent which has thing - benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1337) which is a (A) m-CHR¹²R¹³(As for A same to description above. R¹² shows hydrogen atom , hydroxy group or lower alkanoyl oxy group . R¹³ on phenyl ring shows phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent . m shows 0 or 1 .)

(1350) R⁹ basis
-NR¹⁰R¹¹ benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in the aforementioned (1343) which is

(1351) R⁹ on cycloalkyl group or phenyl ring on phenyl lower alkanoyl group ;phenyl ring which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent as substituent is phenyl group which has times when it possesses group which is chosen from group which becomes amino substitution lower alkoxy group which has the times when it possesses lower alkyl group as amino group , phenyl group and substituent which have times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group , lower alkoxy group , phenyl lower alkoxy group , hydroxy group , lower alkanoyl oxy group , halogen atom substitution lower alkoxy group , nitro group , substituent description above benzo heterocyclic derivative or its salt . which is stated in (1343)

[0165]

benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1343) which is a monocycle of 5 - 11 member rings of saturated or unsaturated where (1352) R⁹ 1 - 4 has the nitrogen atom , oxygen atom or sulfur atom or a heterocyclic group (As substituent becomes lower alkyl group , phenyl group , lower alkanoyl group , halogen atom , phenyl lower alkyl group and oxo group 1 - 3 it is possible to said heterocyclic group to have possessed group which is chosen from group which) of binary ring

(1353) R⁹ on hydrogen atom ;lower alkanoyl oxy group ;lower alkanoyl group ;lower alkoxy group ;phenyl ring on benzoyl group ;lower alkyl group ;lower alkyl thio group ;phenoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on phenoxy lower alkyl group ;phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl lower alkyl group ;phenyl ring which has times when it possesses lower

フェニル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基;ピロリジニル置換低級アルコキシ基;シクロアルケニル基;フェニル低級アルキルアミノカルボニル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基;シアノ基;又は基-(A)m-CHR¹²R¹³(A は前記に同じ。R¹² は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。m は 0 又は 1 を示す。)である前記(1343)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1354)R⁹ が基-NR¹⁰R¹¹ である前記(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1355)R⁹ がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1356)R⁹ が窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1-4 個有する飽和もしくは不飽和の 5-11 員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、

alkyl group as substituent on anilino lower alkyl group ;phenyl ring which has the times when it possesses lower alkyl group as substituent as halogen atom , lower alkoxy carbonyl group and the substituent as substituent lower alkyl group and From group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when it possesses lower alkyl group as substituent from group which becomes the amino carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen on phenyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on benzoyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent on phenyl lower alkenyl group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent as substituent lower alkyl group it possesses amino sulfonyloxy group ;cyano group ; or basis which has times when it possesses lower alkyl group as benzoyl lower alkyl group ;pyrrolidinyl substitution lower alkoxy group ;cycloalkenyl group ;phenyl lower alkyl amino carbonyl group ;substituent which has thing - benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1343) which is a (A) m-CHR¹²R¹³ (As for A same to description above. R¹² shows hydrogen atom , hydroxy group or lower alkanoyl oxy group . R¹³ on phenyl ring shows phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent . m shows 0 or 1 .)

(1354) R⁹ basis -NR¹⁰R¹¹ benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in the aforementioned (1345) which is

(1355) R⁹ on cycloalkyl group or phenyl ring on phenyl lower alkanoyl group ;phenyl ring which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent as substituent is phenyl group which has times when it possesses group which is chosen from group which becomes amino substitution lower alkoxy group which has the times when it possesses lower alkyl group as amino group , phenyl group and substituent which have times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group , lower alkoxy group , phenyl lower alkoxy group , hydroxy group , lower alkanoyl oxy group , halogen atom substitution lower alkoxy group , nitro group , substituent description above benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in (1345)

benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1345) which is a monocycle of 5 - 11 member rings of saturated or unsaturated where (1356) R⁹ 1 - 4 has the nitrogen atom , oxygen atom or

低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を 1~3 個有していてもよい)である前記(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1357)R⁹ が水素原子;低級アルカノイルオキシ基;低級アルカノイル基;低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基;低級アルキル基;低級アルキルチオ基;フェノキシ基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基;フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基;ピロリジニル置換低級アルコキシ基;シクロアルケニル基;フェニル低級アルキルアミノカルボニル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基;シアノ基;又は基-(A)m-CHR¹²R¹³(A は前記に同じ。R¹² は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。m は 0 又は 1 を示す。)である前記(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1358)R² が基-NR⁴R⁵ であり、R³ が水素原子である前記(1347)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1359)R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷ であり、R³ が水素原子である前記(1347)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

sulfur atom or a heterocyclic group (As substituent becomes lower alkyl group, phenyl group, lower alkanoyl group, halogen atom, phenyl lower alkyl group and oxo group 1 - 3 it is possible to said heterocyclic group to have possessed group which is chosen from groupwhich) of binary ring

(1357) R⁹ on hydrogen atom ;lower alkanoyl oxy group ;lower alkanoyl group ;lower alkoxy group ;phenyl ring on benzoyl group ;lower alkyl group ;lower alkyl thio group ;phenoxy group ;phenyl ring which has times when itpossesses lower alkyl group as substituent on phenoxy lower alkyl group ;phenyl ring which has times whenit possesses lower alkyl group as substituent on phenyl lower alkyl group ;phenyl ring which has timeswhen it possesses lower alkyl group as substituent on anilino lower alkyl group ;phenyl ring which has thetimes when it possesses lower alkyl group as substituent as halogen atom , lower alkoxy carbonyl group and the substituent as substituent lower alkyl group and From group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when itpossesses lower alkyl group as substituent from group which becomes the amino carbonyl group which has times when it possesses group which is chosenon phenyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses group which is chosen on benzoyl lower alkoxy group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent on phenyl lower alkenyl group ;phenyl ring which has times when it possesses halogen atom as substituent as substituent lower alkyl group it possesses amino sulfonyloxy group ;cyano group ; or basis which has times when it possesses lower alkyl group as benzoyl lower alkyl group ;pyrrolidinyl substitution lower alkoxy group ;cycloalkenyl group ;phenyl lower alkyl amino carbonyl group ;substituent which has thing - benzo heterocyclic derivative or its salt which isstated in aforementioned (1345) which is a (A) m-CHR¹²R¹³ (As for A same to description above. R¹² shows hydrogen atom , hydroxy group or lower alkanoyl oxy group . R¹³ on phenyl ring shows phenyl lower alkyl group which has fact that itpossesses lower alkyl group as substituent on phenyl group or phenyl ring which hastimes when it possesses lower alkyl group as substituent . m shows 0 or 1 .)

(1358) R² basis -NR⁴R⁵, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in theaforementioned (1347) where R³ is hydrogen atom

(1359) R² basis - with (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷, benzo heterocyclic derivative or its salt which isstated in aforementioned (1347) where R³ is hydrogen atom

(1360) R^2 が水素原子;水酸基;低級アルコキシ基;カルボキシ置換低級アルキル基;シアノ置換低級アルキル基;テトラゾリル基置換低級アルキル基;低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基;低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基;低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基;カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 R^3 が水素原子である前記(1347)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1361) R^3 が水酸基置換低級アルキル基である前記(1347)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0166]

(1362) R^2 と R^3 とが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記(1347)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1363) R^2 が基- NR^4R^5 であり、 R^3 が水素原子である前記(1351)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1364) R^2 が基-(O) m -A-(CO) uNR^6R^7 であり、 R^3 が水素原子である前記(1351)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1365) R^2 が水素原子;水酸基;低級アルコキシ基;カルボキシ置換低級アルキル基;シアノ置換低級アルキル基;テトラゾリル基置換低級アルキル基;低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基;低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基;低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基;カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 R^3 が水素原子である前記(1351)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1366) R^3 が水酸基置換低級アルキル基である前記(1351)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1367) R^2 と R^3 とが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低

(1360) $R^{²}$ with amino substitution lower alkanoyl oxy group ;lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group ;carboxyl substitution lower alkoxy group or lower alkanoyl group which has times when it possesses lower alkyl group as hydrogen atom ;hydroxy group ;lower alkoxy group ;carboxy substituted lower alkyl group ;cyano substituted lower alkyl group ;tetrazolyl group substituted lower alkyl group ;lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group ;lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group ;substituent , benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in theaforementioned (1347) where $R^{³}$ is hydrogen atom

benzo heterocyclic derivative or its salt . which is stated in aforementioned (1347) where (1361) $R^{³}$ is hydroxyl group substitution lower alkyl group

[0166]

(1362) $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1347) which forms oxo group , lower alkylidene group , lower alkoxy-substituted lower alkylidene group , lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group , or phenyl substitution lower alkylidene group

(1363) $R^{²}$ basis - $NR^{⁴}R^{⁵}$, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in theaforementioned (1351) where $R^{³}$ is hydrogen atom

(1364) $R^{²}$ basis - with (O) m -A- (CO) $uNR^{⁶}R^{⁷}$, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1351) where $R^{³}$ is hydrogen atom

(1365) $R^{²}$ with amino substitution lower alkanoyl oxy group ;lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group ;carboxyl substitution lower alkoxy group or lower alkanoyl group which has times when it possesses lower alkyl group as hydrogen atom ;hydroxy group ;lower alkoxy group ;carboxy substituted lower alkyl group ;cyano substituted lower alkyl group ;tetrazolyl group substituted lower alkyl group ;lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group ;lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group ;substituent , benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in theaforementioned (1351) where $R^{³}$ is hydrogen atom

benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1351) where (1366) $R^{³}$ is hydroxyl group substitution lower alkyl group

(1367) $R^{²}$ and $R^{³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1351) which forms oxo group ,

級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記(1351)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1368) R^2 が基- NR^4R^5 であり、 R^3 が水素原子である前記(1355)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1369) R^2 が基-(O) m -A-(CO) nNR^6R^7 であり、 R^3 が水素原子である前記(1355)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1370) R^2 が水素原子;水酸基;低級アルコキシ基;カルボキシ置換低級アルキル基;シアノ置換低級アルキル基;テトラゾリル基置換低級アルキル基;低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基;低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基;低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基;カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 R^3 が水素原子である前記(1355)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1371) R^3 が水酸基置換低級アルキル基である前記(1355)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0167]

(1372) R^2 と R^3 とが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記(1355)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1373) m が 0、 n が 1、 R^6 及び R^7 が同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記(1359)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1374) m が 0、 n が 1、 R^6 及び R^7 が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する 5-7 員環の飽和複素環基(該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基

lower alkylidene group, lower alkoxy-substituted lower alkylidene group, lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group, or phenyl substitution lower alkylidene group

(1368) $R^{2²}$ basis
- $NR^{4⁴}R^{5⁵}$, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in theaforementioned (1355) where $R^{3³}$ is hydrogen atom

(1369) $R^{2²}$ basis - with (O) m -A-(CO) $nNR^{6⁶}R^{7⁷}$, benzo heterocyclic derivative or its salt which isstated in aforementioned (1355) where $R^{3³}$ is hydrogen atom

(1370) $R^{2²}$ with amino substitution lower alkanoyl oxy group; lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group; carboxyl substitution lower alkoxy group or lower alkanoyl group which has times when it possesses lower alkyl group as hydrogen atom; hydroxy group; lower alkoxy group; carboxy substituted lower alkyl group; cyano substituted lower alkyl group; tetrazolyl group substituted lower alkyl group; lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group; lower alkoxy carbonyl substituted lower alkyl group; substituent, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in theaforementioned (1355) where $R^{3³}$ is hydrogen atom

benzo heterocyclic derivative or its salt, which is stated in aforementioned (1355) where (1371) $R^{3³}$ is hydroxyl group substitution lower alkyl group

[0167]

(1372) $R^{2²}$ and $R^{3³}$ becoming simultaneous, benzo heterocyclic derivative or its salt which isstated in aforementioned (1355) which forms oxo group, lower alkylidene group, lower alkoxy-substituted lower alkylidene group, lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group, or phenyl substitution lower alkylidene group

(1373) m 0, n 1, $R^{6⁶}$ and $R^{7⁷}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1359) which is a phenyl group which has thetimes when it possesses halogen atom on amino substituted lower alkyl group, carbamoyl group substituted lower alkyl group, adamantyl group substituted lower alkyl group, lower alkyl sulfonyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as alike or different, hydrogen atom, lower alkoxy group, lower alkyl group, substituent

(1374) m 0, n 1, with nitrogen atom which $R^{6⁶}$ and the $R^{7⁷}$ connect through nitrogen atom or oxygen atom or benzo heterocyclic derivative or its salt which isstated in aforementioned (1359) which is a saturated heterocycle basic (On said heterocycle, group which is

が置換していてもよい。)である前記(1359)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1375)m 及び n が共に 1 である前記(1359)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1376)m が 0、n が 1、 R^6 及び R^7 が同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記(1364)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1377)m が 0、n が 1、 R^6 及び R^7 が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する 5-7 員環の飽和複素環基(該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)である前記(1364)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1378)m 及び n が共に 1 である前記(1364)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1379)m が 0、n が 1、 R^6 及び R^7 が同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1380)m が 0、n が 1、 R^6 及び R^7 が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する 5-7 員環の飽和複素環基(該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1381)m 及び n が共に 1 である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

[0168]

(1382) R^1 が水素原子又はハロゲン原子である前記(1336)-(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

chosen from group which becomes lower alkyl group and phenyl lower alkyl group optionally substitutable .) 5 - 7 -member ring where it forms without minding

benzo heterocyclic derivative or its salt which (1375) m and n together 1 states in aforementioned(1359) which is

(1376) m 0, n 1, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1364) which is a phenyl group which has the times when it possesses halogen atom on amino substituted lower alkyl group, carbamoyl group substituted lower alkyl group, adamantyl group substituted lower alkyl group, lower alkyl sulfonyl group or phenyl ring which has the times when it possesses lower alkyl group as alike or different, hydrogen atom, lower alkoxy group, lower alkyl group, substituent

(1377) m 0, n 1, with nitrogen atom which $R^{⁶}$ and the $R^{⁷}$ connect through nitrogen atom or oxygen atom or benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1364) which is a saturated heterocycle basic (On said heterocycle, group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and phenyl lower alkyl group optionally substitutable .) 5 - 7 -member ring where it forms without minding

benzo heterocyclic derivative or its salt which (1378) m and n together 1 states in aforementioned(1364) which is

(1379) m 0, n 1, $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1369) which is a phenyl group which has the times when it possesses halogen atom on amino substituted lower alkyl group, carbamoyl group substituted lower alkyl group, adamantyl group substituted lower alkyl group, lower alkyl sulfonyl group or phenyl ring which has the times when it possesses lower alkyl group as alike or different, hydrogen atom, lower alkoxy group, lower alkyl group, substituent

(1380) m 0, n 1, with nitrogen atom which $R^{⁶}$ and the $R^{⁷}$ connect through nitrogen atom or oxygen atom or benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1369) which is a saturated heterocycle basic (On said heterocycle, group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and phenyl lower alkyl group optionally substitutable .) 5 - 7 -member ring where it forms without minding

benzo heterocyclic derivative or its salt . which (1381) m and n together 1 states in aforementioned(1369) which is

[0168]

Description above where (1382) $R^{¹}$ is hydrogen atom or halogen atom (1336) - benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in (1345)

(1383)R¹ が低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基である前記(1336)~(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1384)R² が基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷ であり、R³ が水素原子である前記(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1385)5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[4-(4-メトキシフェニル)-2-メチルベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン

(1386)5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[4-(4-シクロヘキシル-2-メチルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン

(1387)5-イソプロピルアミノカルボニルメチル-1-(2-クロロ-4-ジメチルアミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン。

[0169]

上記一般式(1)に示される各基はより具体的にはそれぞれ次の通りである。

[0170]

低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、tert-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

[0171]

低級アルキル基としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

[0172]

ハロゲン原子としては、例えば弗素原子、塩素原子、臭素原子及び沃素原子が挙げられる。

[0173]

(1383) R¹ description above which is a amino carbonyl lower alkoxy group which has the times when it possesses lower alkyl group as amino group, carboxy substitution lower alkoxy group, lower alkoxy carbonyl substitution lower alkoxy group or substituent which has times when it possesses lower alkyl group as amino lower alkoxy group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and lower alkanoyl group as lower alkyl group, lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, substituent (1336) - benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in (1345)

(1384) R² basis - with (O) m-A- (CO) uNR⁶R⁷, benzo heterocyclic derivative or its salt which is stated in aforementioned (1345) where R³ is hydrogen atom

(1385) 5 - [(4 -methyl -1- piperazinyl) carbonyl methyl] - 1 - [4 - (4 -methoxyphenyl) - 2 -methyl benzoyl] - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine

(1386) 5 - [(4 -methyl -1- piperazinyl) carbonyl methyl] - 1 - (4 - (4 -cyclohexyl -2- methyl benzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine

(1387) 5 -isopropyl amino carbonyl methyl -1- (2 -chloro -4- dimethylamino benzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine .

[0169]

Each basis which is shown in above-mentioned General Formula (1) seems the respective following way more concretely.

[0170]

As lower alkoxy group, straight or branched condition alkoxy group of for example methoxy, ethoxy, propoxy, isopropoxy, butoxy, t- butoxy, pentyloxy, hexyloxy group or other carbon number 1~6 can be illustrated.

[0171]

As lower alkyl group, straight or branched condition alkyl group of for example methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, t- butyl, pentyl, hexyl group or other carbon number 1~6 can be listed.

[0172]

As halogen atom, you can list for example fluorine atom, chlorine atom, bromine atom and iodine atom .

[0173]

低級アルカノイルオキシ基としては、例えばホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、ペンタノイルオキシ、tert-ブチルカルボニルオキシ、ヘキサノイルオキシ等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイルオキシ基を挙げることができる。

【0174】

置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基としては、例えば 2,2,2-トリフルオロアセチル、2,2,2-トリクロロアセチル、2-クロロアセチル、2-ブロモアセチル、2-フルオロアセチル、2-ヨードアセチル、2,2-ジフルオロアセチル、2,2-ジブロモアセチル、3,3,3-トリフルオロプロピオニル、3,3,3-トリクロロプロピオニル、3-クロロプロピオニル、2,3-ジクロロプロピオニル、4,4,4-トリクロロブチリル、4-フルオロブチリル、5-クロロペンタノイル、3-クロロ-2-メチルプロピオニル、6-ブロモヘキサノイル、5,6-ジブロモヘキサノイル等の置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有していてもよい炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイル基を挙げることができる。

【0175】

置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基としては、例えばアミノメキシ、2-アミノエトキシ、1-アミノエトキシ、3-アミノプロポキシ、4-アミノブトキシ、5-アミノペンチルオキシ、6-アミノヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-アミノエトキシ、2-メチル-3-アミノプロポキシ、アセチルアミノメキシ、1-アセチルアミノエトキシ、2-プロピオニルアミノエトキシ、3-イソプロピオニルアミノプロポキシ、4-ブチリルアミノブトキシ、5-ペンタノイルアミノペンチルオキシ、6-ヘキサノイルアミノヘキシルオキシ、ホルミルアミノメキシ、メチルアミノメキシ、1-エチルアミノエトキシ、2-プロピルアミノエトキシ、3-イソプロピルアミノプロポキシ、4-ブチルアミノブトキシ、5-ペンチルアミノペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ、ジメチルアミノメキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エトキシ等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群より選ばれた基を 1~2 個有することのあるアミノ基を有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0176】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、メチルアミノ、

As lower alkanoyl oxy group, alkanoyl oxy group of straight or branched condition of for example formyl oxy, acetyl oxy, propanoyl oxy, butyryl oxy, isobutyryl oxy, pentanoyl oxy, t- butyl carbonyl oxy, hexanoyl oxy group or other carbon number 1~6 can be listed.

【0174】

As lower alkanoyl group which has fact that it possesses halogen atom as the substituent, 1 - 3 is possible to have possessed halogen atom as for example 2, 2, 2-trifluoroacetyl, 2, 2, 2- trichloroacetyl, 2- chloroacetyl, 2- bromo acetyl, 2- fluoro acetyl, 2- iodo acetyl, 2, 2- difluoro acetyl, 2, 2- dibromo acetyl, 3, 3, 3- trifluoro propanoyl, 3, 3, 3- trichloro propanoyl, 3- chloro propanoyl, 2, 3- dichloro propanoyl, 4, 4, 4- trichloro butyryl, 4- fluoro butyryl, 5-chloro pentanoyl, 3- chloro -2- methyl propanoyl, 6-bromo hexanoyl, 5, 6-dibromo hexanoyl group or other substituent the alkanoyl group of straight or branched condition of carbon number 1~6 which can be listed.

【0175】

As amino lower alkoxy group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and lower alkanoyl group as the substituent, straight or branched condition alkoxy group of carbon number 1~6 which possesses amino group which has times when 1 - 2 it possesses group which is chosen can be illustrated from group which becomes straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 and straight or branched condition alkanoyl group of carbon number 1~6 as for example amino methoxy, 2- amino ethoxy, 1- amino ethoxy, 3- amino propoxy, 4- amino butoxy, 5-amino pentyloxy, 6-amino hexyloxy, 1, 1- dimethyl -2- amino ethoxy, 2- methyl -3- amino propoxy, acetyl amino methoxy, 1- acetyl amino ethoxy, 2- propanoyl amino ethoxy, 3- isopropionyl amino propoxy, 4- butyryl amino butoxy, 5-pentanoyl amino pentyloxy, 6-hexanoyl amino hexyloxy, formyl amino methoxy, methyl amino methoxy, 1- ethyl amino ethoxy, 2- propyl amino ethoxy, 3- isopropyl amino propoxy, 4- butyl amino butoxy, 5-pentyl amino pentyloxy, 6-hexyl amino hexyloxy, dimethyl amino methoxy, (N- ethyl -N- propyl amino) methoxy, 2- (N- methyl -N- hexyl amino) ethoxy group or other substituent .

【0176】

As amino group which has fact that it possesses lower alkyl group as the substituent, 1 - 2 it possesses straight or

エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0177】

低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基としては、例えばメトキシカルボニルメトキシ、3-メトキシカルボニルプロポキシ、エトキシカルボニルメトキシ、3-エトキシカルボニルプロポキシ、4-エトキシカルボニルブトキシ、5-イソプロポキシカルボニルペンチルオキシ、6-プロポキシカルボニルヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-ブトキシカルボニルエトキシ、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロポキシ、2-ペンチルオキシカルボニルエトキシ、ヘキシルオキシカルボニルメトキシ基等のアルコキシカルボニル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基である炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルアルコキシ基を挙げることができる。

【0178】

カルボキシ基置換低級アルコキシ基としては、例えば、カルボキシメトキシ、2-カルボキシエトキシ、1-カルボキシエトキシ、3-カルボキシプロポキシ、4-カルボキシブトキシ、5-カルボキシペンチルオキシ、6-カルボキシヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-カルボキシエトキシ、2-メチル-3-カルボキシプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるカルボキシアルコキシ基を挙げることができる。

【0179】

置換基として低級アルキル基を有するアミノカルボニル低級アルコキシ基としては、メチルアミノカルボニルメトキシ、1-エチルアミノカルボニルエトキシ、2-プロピルアミノカルボニルエトキシ、3-イソプロピルアミノカルボニルプロポキシ、4-ブチルアミノカルボニルブトキシ、5-ペンチルアミノカルボニルペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノカルボニルヘキシルオキシ、ジメチルアミノカルボニルメトキシ、3-ジエチルアミノカルボニルプロポキシ、ジエチルアミノカルボニルメトキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)カルボニルメトキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)カルボニルエトキシ基

branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as for example amino, methylamino, ethylamino, propyl amino, isopropyl amino, butyl amino, t- butyl amino, pentyl amino, hexyl amino, dimethylamino, diethyl amino, dipropyl amino, dibutyl amino, di pentyl amino, di hexyl amino, N- methyl -N- ethylamino, N- ethyl -N- propyl amino, N- methyl -N- butyl amino, N- methyl -N- hexyl amino group or other substituent amino group which has fact that can be illustrated.

【0177】

As lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group, straight or branched condition alkoxy carbonyl alkoxy group of the carbon number 1~6 where for example methoxycarbonyl methoxy, 3- methoxycarbonyl propoxy, ethoxy carbonyl methoxy, 3- ethoxy carbonyl propoxy, 4- ethoxy carbonyl butoxy, 5-isopropoxy carbonyl pentyloxy, 6-propoxy carbonyl hexyloxy, 1, 1- dimethyl -2- butoxy carbonyl ethoxy, 2- methyl -3- t- butoxy carbonyl propoxy, 2- pentyloxy carbonyl ethoxy, hexyloxy carbonyl methoxy group or other alkoxy carbonyl portion is straight or branched condition alkoxy carbonyl group of carbon number 1~6 can belisted.

【0178】

As carboxyl substitution lower alkoxy group, carboxy alkoxy group where for example carboxy methoxy, 2- carboxy ethoxy, 1- carboxy ethoxy, 3- carboxy propoxy, 4- carboxy butoxy, 5-carboxy pentyloxy, 6-carboxy hexyloxy, 1, 1- dimethyl -2- carboxy ethoxy, 2- methyl -3- carboxy propoxy group or other alkoxy portion is the straight or branched condition alkoxy group of carbon number 1~6 can be listed.

【0179】

As amino carbonyl lower alkoxy group which possesses lower alkyl group as substituent, 1 - 2 possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as methylamino carbonyl methoxy, 1- ethylamino carbonyl ethoxy, 2- propyl amino carbonyl ethoxy, 3- isopropyl amino carbonyl propoxy, 4- butyl amino carbonyl butoxy, 5-pentyl amino carbonyl pentyloxy, 6-hexyl amino carbonyl hexyloxy, dimethylamino carbonyl methoxy, 3- diethyl amino carbonyl propoxy, diethyl amino carbonyl methoxy, (N- ethyl -N- propyl amino) carbonyl methoxy, 2- (N- methyl -N- hexyl amino) carbonyl ethoxy group or other substituent straight or branched condition alkoxy group of

等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有するアミノカルボニル基を有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0180】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-クロロベンゾイル、4-クロロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-フルオロベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、2-ブロモベンゾイル、3-ブロモベンゾイル、4-ブロモベンゾイル、2-ヨードベンゾイル、3-ヨードベンゾイル、4-ヨードベンゾイル、3,4-ジクロロベンゾイル、2,6-ジクロロベンゾイル、2,3-ジクロロベンゾイル、2,4-ジクロロベンゾイル、3,4-ジフルオロベンゾイル、3,5-ジフルオロベンゾイル、3,4,5-トリクロロベンゾイル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0181】

カルボキシ置換低級アルキル基としては、例えばカルボキシメチル、2-カルボキシエチル、1-カルボキシエチル、3-カルボキシプロピル、4-カルボキシブチル、5-カルボキシペンチル、6-カルボキシヘキシル、1,1-ジメチル-2-カルボキシエチル、2-メチル-3-カルボキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルボキシアルキル基を挙げることができる。

【0182】

低級アルコキシカルボニル基置換低級アルキル基としては、例えばメトキシカルボニルメチル、3-メトキシカルボニルプロピル、エトキシカルボニルメチル、3-エトキシカルボニルプロピル、4-エトキシカルボニルブチル、5-イソプロポキシカルボニルペンチル、6-プロポキシカルボニルヘキシル、1,1-ジメチル-2-ブトキシカルボニルエチル、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロピル、2-ペンチルオキシカルボニルエチル、ヘキシルオキシカルボニルメチル基等のアルコキシカルボニル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基である炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルアルキル基を挙げることができる。

【0183】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基としては、例えば、2-アミノアセチルオキシ、3-アミノプロピオニルオキシ、2-アミノプロピオニルオキシ

carbon number 1~6 which possesses amino carbonyl group which can be illustrated.

【0180】

On phenyl ring benzoyl group which has fact that 1 - 3 it possesses the halogen atom as substituent can be illustrated on for example benzoyl, 2- chlorobenzoyl, 3- chlorobenzoyl, 4- chlorobenzoyl, 2- fluoro benzoyl, 3- fluoro benzoyl, 4- fluoro benzoyl, 2- bromo benzoyl, 3- bromo benzoyl, 4- bromo benzoyl, 2- iodo benzoyl, 3- iodo benzoyl, 4- iodo benzoyl, 3, 4- dichloro benzoyl, 2, 6-dichloro benzoyl, 2, 3- dichloro benzoyl, 2, 4- dichloro benzoyl, 3, 4- difluoro benzoyl, 3, 5-dibromo benzoyl, 3, 4, 5-trichloro benzoyl group or other phenyl ring as benzoyl group which has fact that it possesses halogen atom as substituent.

【0181】

As carboxy substituted lower alkyl group, carboxyalkyl group where for example carboxymethyl, 2- carboxy ethyl, 1- carboxy ethyl, 3- carboxy propyl, 4- carboxy butyl, 5-carboxy pentyl, 6-carboxy hexyl, 1, 1- dimethyl -2- carboxy ethyl, 2- methyl -3- carboxy propyl group or other alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 can be listed.

【0182】

As lower alkoxy carbonyl group substituted lower alkyl group, straight or branched condition alkoxy carbonyl alkyl group of carbon number 1~6 where for example methoxycarbonyl methyl, 3- methoxycarbonyl propyl, ethoxy carbonyl methyl, 3- ethoxy carbonyl propyl, 4- ethoxy carbonyl butyl, 5-isopropoxy carbonyl pentyl, 6-propoxy carbonyl hexyl, 1, 1- dimethyl -2- butoxy carbonyl ethyl, 2- methyl -3- t- butoxy carbonyl propyl, 2- pentyloxy carbonyl ethyl, hexyloxy carbonyl methyl group or other alkoxy carbonyl portion is straight or branched condition alkoxy carbonyl group of carbon number 1~6 can be listed.

【0183】

As amino substitution lower alkanoyl oxy group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent, 1 - 2 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as for example 2- amino acetyl oxy, 3- amino

シ、4-アミノブチルオキシ、2,2-ジメチル-3-アミノプロピオニルオキシ、5-アミノペンタノイルオキシ、6-アミノヘキサノイルオキシ、2-メチル-3-アミノプロピオニルオキシ、2-メチルアミノアセチルオキシ、3-エチルアミノプロピオニルオキシ、2-プロピルアミノプロピオニルオキシ、4-イソプロピルアミノブチルオキシ、4-ブチルアミノブチルオキシ、4-tert-ブチルアミノブチルオキシ、5-ペンチルアミノペンタノイルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキサノイルオキシ、2-ジメチルアミノアセチルオキシ、3-ジエチルアミノプロピオニルオキシ、2-ジメチルアミノプロピオニルオキシ、2-(N-エチル-N-プロピルアミノ)アセチルオキシ、3-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)プロピオニルオキシ基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基を有する炭素数が 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基を例示できる。

[0184]

低級アルカノイル基としては、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチル、イソブチル、ペンタノイル、tert-ブチルカルボニル、ヘキサノイル基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基が挙げられる。

[0185]

低級アルキリデン基としては、例えば、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、ペンチリデン、ヘキシリデン基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

[0186]

低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基としては、例えばエトキシカルボニルメチリデン、2-メトキシカルボニルエチリデン、3-イソプロポキシカルボニルプロピリデン、2-プロポキシカルボニルイソプロピリデン、4-ブトキシカルボニルブチリデン、5-ペンチルオキシカルボニルペンチリデン、6-ヘキシルオキシカルボニルヘキシリデン基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基置換炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

[0187]

低級アルコキシ置換低級アルキリデン基としては、例えば、メトキシメチリデン、2-エトキシエチリデン、3-プロポキシプロピリデン、2-イソプロポキシイソプロピリデン、4-ブトキシブチリデン、5-ペンチルオキシペンチリデン、6-ヘキシルオキシヘキシリデン基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基置換炭素数 1~6 の直鎖又

propanoyl oxy, 2- amino propanoyl oxy, 4- amino butyryl oxy, 2, 2- dimethyl -3- amino propanoyl oxy, 5- amino pentanoyl oxy, 6- amino hexanoyl oxy, 2- methyl -3- amino propanoyl oxy, 2- methylamino acetyl oxy, 3- ethylamino propanoyl oxy, 2- propyl amino propanoyl oxy, 4- isopropyl amino butyryl oxy, 4- butyl amino butyryl oxy, 4- t- butyl amino butyryl oxy, 5- pentyl amino pentanoyl oxy, 6- hexyl amino hexanoyl oxy, 2- dimethylamino acetyl oxy, 3- diethyl amino propanoyl oxy, 2- dimethylamino propanoyl oxy, 2- (N- ethyl -N- propyl amino) acetyl oxy, 3- (N- methyl -N- hexyl amino) propanoyl oxy group or other substituent carbon number which possesses amino group which has times when can illustrate straight or branched condition alkanoyl oxy group 2 - 6.

[0184]

As lower alkanoyl group, you can list straight or branched condition alkanoyl group of for example formyl, acetyl, propanoyl, butyryl, isobutyryl, pentanoyl, t- butyl carbonyl, hexanoyl group or other carbon number 1~6.

[0185]

As lower alkylidene group, straight or branched condition alkylidene group of for example methylidene, ethylidene, propylidene, isopropylidene, butylidene, pentylidene, hexylidene basic or other carbon number 1~6 can be illustrated.

[0186]

As lower alkoxy carbonyl substitution lower alkylidene group, straight or branched condition alkylidene group of the straight or branched condition alkoxy carbonyl group substitute carbon Mathematical Formula 1 ~6 of for example ethoxy carbonyl methylidene, 2- methoxycarbonyl ethylidene, 3- isopropoxy carbonyl propylidene, 2- propoxy carbonyl isopropylidene, 4- butoxy carbonyl butylidene, 5- pentyloxy carbonyl pentylidene, 6- hexyloxy carbonyl hexylidene basic or other carbon number 1~6 can be illustrated.

[0187]

As lower alkoxy-substituted lower alkylidene group, straight or branched condition alkylidene group of straight or branched condition alkoxy group substitute carbon Mathematical Formula 1 ~6 of for example methoxy methylidene, 2- ethoxy ethylidene, 3- propoxy propylidene, 2- isopropoxy isopropylidene, 4- butoxy butylidene, 5- pentyloxy pentylidene, 6- hexyloxy hexylidene basic or

は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

【0188】

フェニル置換低級アルキリデン基としては、例えばフェニルメチリデン、2-フェニルエチリデン、3-フェニルプロピリデン、2-フェニルプロピリデン、4-フェニルブチリデン、5-フェニルペンチリデン、6-フェニルヘキシリデン基等のフェニル置換炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキリデン基を例示できる。

【0189】

低級アルキレン基としては、例えばメチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を例示できる。

【0190】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基としては、例えば、アミノメチル、2-アミノエチル、1-アミノエチル、3-アミノプロピル、4-アミノブチル、5-アミノペンチル、6-アミノヘキシル、1,1-ジメチル-2-アミノエチル、2-メチル-3-アミノプロピル、メチルアミノメチル、1-エチルアミノエチル、2-プロピルアミノエチル、3-イソプロピルアミノプロピル、4-ブチルアミノブチル、5-ペンチルアミノペンチル、6-ヘキシルアミノヘキシル、ジメチルアミノメチル、2-ジエチルアミノエチル、2-ジメチルアミノエチル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基を有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0191】

R^6 及び R^7 又は R^B 及び R^C が結合する窒素原子と共に、窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する 5~7 員環の飽和複素環基としては、例えばピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、ホモピペラジニル基等を例示できる。

【0192】

低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換した上記複素環基としては、例えば、4-メチルピペラジニル、3,4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、

other carbon number 1~6 can be illustrated.

【0188】

As phenyl substitution lower alkylidene group, alkylidene group of straight or branched condition of the for example phenyl methylidene, 2- phenyl ethylidene, 3- phenyl propylidene, 2- phenyl propylidene, 4- phenyl butylidene, 5-phenyl pentylidene, 6-phenyl hexylidene basic or other phenyl substitute carbon Mathematical Formula 1 ~6 can be illustrated.

【0189】

As lower alkylene group, straight or branched condition alkylene group of for example methylene, ethylene, trimethylene, 2- methyl trimethylene, 2, 2- dimethyl trimethylene, 1- methyl trimethylene, methyl methylene, ethyl methylene, tetramethylene, pentamethylene, hexamethylene group or other carbon number 1~6 can be illustrated.

【0190】

As amino substituted lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as the substituent, 1 - 2 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as for example aminomethyl, 2- aminoethyl, 1- aminoethyl, 3- aminopropyl, 4- amino butyl, 5-amino pentyl, 6-amino hexyl, 1, 1- dimethyl -2- aminoethyl, 2- methyl -3- aminopropyl, methylamino methyl, 1- ethylamino ethyl, 2- propyl aminoethyl, 3- isopropyl aminopropyl, 4- butyl amino butyl, 5-pentyl amino pentyl, 6-hexyl amino hexyl, dimethylamino methyl, 2- diethyl aminoethyl, 2- dimethylamino ethyl, (N- ethyl -N- propyl amino) methyl, 2- (N- methyl -N- hexyl amino) ethyl group or other substituent straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 which possesses amino group which has times when can be illustrated.

【0191】

With nitrogen atom which $R^{⁶}$ and $R^{⁷}$ or $R^{^B}$ and the $R^{^C}$ connect, through nitrogen atom or oxygen atom or connecting mutually without minding, it can illustrate for example pyrrolidinyl, bipyridinyl, piperazinyl, morpholino, homo piperazinyl group etc 5 - 7 -member ring where it forms as saturated heterocycle basis.

【0192】

As above-mentioned heterocyclic group which group which is chosen from the group which becomes lower alkyl group and phenyl lower alkyl group substitutes, straight or branched condition alkyl group and alkyl portion of for example 4-methyl piperazinyl, 3, 4- dimethyl piperazinyl, 3- ethyl

3,4,5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-エチルホモピペラジニル、4-メチルホモピペラジニル、4-ヘキシルピペラジニル、4-ジフェニルメチルピペラジニル、4-ベンジルピペラジニル、3-メチル-4-ベンジルピペラジニル、3-(2-フェニルエチル)ピロリジニル、2-(1-フェニルエチル)ピロリジニル、4-(3-フェニルプロピル)ピペリジニル、3-(4-フェニルブチル)モルホリノ、3-(5-フェニルペンチル)ピペリジニル、4-(6-フェニルヘキシル)ピペラジニル基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、フェニル基を 1~2 個有するアルキル基なる群から選ばれた基が 1~3 個置換した上記複素環基を例示できる。

【0193】

低級アルキル基が置換した上記複素環基としては、例えば、4-メチルピペラジニル、3,4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、3,4,5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-メチルホモピペラジニル、4-ヘキシルピペラジニル基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基が 1~3 個置換した上記複素環基を例示できる。

【0194】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-プロピルフェニル、4-ブチルフェニル、2-ペンチルフェニル、3-ヘキシルフェニル、3,4-ジメチルフェニル、3,4,5-トリメチルフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~3 個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0195】

フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-プロポキシフェニル、4-ブトキシフェニル、2-ペンチルオキシフェニル、3-ヘキシルオキシフェニル、2,4-ジメトキシフェニル、3,4-ジエトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を 1~3 個有することのあるフェニル基を例示できる。

pyrrolidinyl, 2-propyl pyrrolidinyl, 1-methyl pyrrolidinyl, 3, 4, 5-trimethyl bipyridinyl, 4-butyl bipyridinyl, 3-pentyl morpholino, 4-ethyl homo piperazinyl, 4-methyl homo piperazinyl, 4-hexyl piperazinyl, 4-diphenylmethyl piperazinyl, 4-benzyl piperazinyl, 3-methyl-4-benzyl piperazinyl, 3-(2-phenylethyl) pyrrolidinyl, 2-(1-phenylethyl) pyrrolidinyl, 4-(3-phenyl propyl) bipyridinyl, 3-(4-phenyl butyl) morpholino, 3-(5-phenyl pentyl) bipyridinyl, 4-(6-phenyl hexyl) piperazinyl group or other carbon number 1~6 with straight or branched condition alkyl group of the carbon number 1~6, group which is chosen from group which becomes alkyl group which 1 - 2 possesses phenyl group 1 - 3 can illustrate above-mentioned heterocyclic group which is substituted.

【0193】

straight or branched condition alkyl group and alkyl portion of for example 4- methyl piperazinyl, 3, 4- dimethyl piperazinyl, 3- ethyl pyrrolidinyl, 2- propyl pyrrolidinyl, 1- methyl pyrrolidinyl, 3, 4, 5-trimethyl bipyridinyl, 4- butyl bipyridinyl, 3- pentyl morpholino, 4- methyl homo piperazinyl, 4- hexyl piperazinyl group or other carbon number 1~6 straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 1 - 3 above-mentioned heterocyclic group which is substituted can be illustrated as above-mentioned heterocyclic group which the lower alkyl group substitutes.

【0194】

On phenyl ring phenyl group which has fact that 1 - 3 it possesses the straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as substituent can be illustrated on for example phenyl, 2- methylphenyl, 3- methylphenyl, 4- methylphenyl, 2- ethyl phenyl, 3- propyl phenyl, 4- butyl phenyl, 2- pentyl phenyl, 3- hexyl phenyl, 3, 4- dimethylphenyl, 3, 4, 5-trimethyl phenyl group or other phenyl ring as phenyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent.

【0195】

On phenyl ring phenyl group which has fact that 1 - 3 it possesses the straight or branched condition alkoxy group of carbon number 1~6 as substituent can be illustrated on for example phenyl, 2- methoxyphenyl, 3- methoxyphenyl, 4- methoxyphenyl, 2- ethoxy phenyl, 3- propoxy phenyl, 4- butoxy phenyl, 2- pentyloxy phenyl, 3- hexyloxy phenyl, 2, 4- dimethoxy phenyl, 3, 4- diethoxy phenyl, 3, 4, 5-trimethoxy phenyl group or other phenyl ring as phenyl group which has fact that it possesses lower alkoxy group as substituent.

ニル基を例示できる。

【0196】

ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基としては、例えば、ピリジルカルボニル、2-フェニルピリジルカルボニル、3-フェニルピリジルカルボニル、4-フェニルピリジルカルボニル、2-(2-メチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-エチルフェニル)ピリジルカルボニル、4-(3-プロピルフェニル)ピリジルカルボニル、2-(4-ブチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-ペンチルフェニル)ピリジルカルボニル、4-(3-ヘキシルフェニル)ピリジルカルボニル、2-(3,4-ジメチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(3,4,5-トリメチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-ピリジル)ピリジルカルボニル、2-(3-ピリジル)ピリジルカルボニル、4-(4-ピリジル)ピリジルカルボニル基等のピリジン環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~3 個有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基を例示できる。

【0197】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、

且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、

例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1,1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、2-クロロベンジル、2-(3-クロロフェニル)エチル、2-フルオロベンジル、1-(4-クロロフェニル)エチル、3-(2-フルオロフェニル)プロピル、4-(3-フルオロフェニル)ブチル、5-(4-フルオロフェニル)ペンチル、1,1-ジメチル-2-(2-ブロモフェニル)エチル、6-(3-ブロモフェニル)ヘキシル、4-ブロモベンジル、2-(2-ヨードフェニル)エチル、1-(3-ヨードフェニル)エチル、3-(4-ヨードフェニル)プロピル、3,4-ジクロロベンジル、3,5-ジクロロベンジル、2,6-ジクロロベンジル、2,3-ジクロロベンジル、2,4-ジクロロベンジル、3,4-ジフルオロベンジル、3,5-ジフルオロベンジル、3,4,5-トリクロロベンジル、3,5-ジメチル-4-ヒドロキシベンジル、2-メトキシ-3-クロロベンジル、2-メチルベンジル、2-(2-メチルフェニル)エチル、1-(3-メチルフェニル)エチル、3-(4-

【0196】

On pyridine ring as substituent on phenyl ring as pyridyl carbonyl group which has factthat it possesses group which is chosen from group which becomes phenyl group and pyridyl group which have times when it possesses lower alkyl group as substituent , On for example pyridyl carbonyl , 2- phenyl pyridyl carbonyl , 3- phenyl pyridyl carbonyl , 4- phenyl pyridyl carbonyl , 2- (2 -methylphenyl) pyridyl carbonyl , 3- (2 -ethyl phenyl) pyridyl carbonyl , 4- (3 -propyl phenyl) pyridyl carbonyl , 2- (4 -butyl phenyl) pyridyl carbonyl , 3- (2 -pentyl phenyl) pyridyl carbonyl , 4- (3 -hexyl phenyl) pyridyl carbonyl , 2- (3 and 4 -dimethylphenyl) pyridyl carbonyl , 3- (3, 4 and 5 -trimethyl phenyl) pyridyl carbonyl , 3- (2 -pyridyl) pyridyl carbonyl , 2- (3 -pyridyl) pyridyl carbonyl , 4- (4 -pyridyl) pyridyl carbonyl group or other pyridine ring pyridyl carbonyl group which has factthat it possesses group which is chosen can be illustrated fromgroup which becomes phenyl group and pyridyl group which have timeswhen 1 - 3 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as the substituent .

【0197】

On phenyl ring there are times when it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and halogen atom as the substituent ,

At same time as phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses the hydroxy group in lower alkyl group portion ,

for example benzyl , 2- phenylethyl , 1- phenylethyl , 3- phenyl propyl , 4- phenyl butyl , 1, 1- dimethyl -2- phenylethyl , 5-phenyl pentyl , 6-phenyl hexyl , 2- methyl -3- phenyl propyl , 2- chloro benzyl , 2- (3 -chlorophenyl) ethyl , 2- fluoro benzyl , 1- (4 -chlorophenyl) ethyl , 3- (2 -fluorophenyl) propyl , 4- (3 -fluorophenyl) butyl , 5- (4 -fluorophenyl) pentyl , 1, 1- dimethyl -2- (2 -bromophenyl) ethyl , 6- (3 -bromophenyl) hexyl , 4- bromo benzyl , 2- (2 -iodo phenyl) ethyl , 1- (3 -iodo phenyl) ethyl , 3- (4 -iodo phenyl) propyl , 3, 4- dichloro benzyl , 3, 5-dichloro benzyl , 2, 6-dichloro benzyl , 2, 3- dichloro benzyl , 2, 4- dichloro benzyl , 3, 4- difluoro benzyl , 3, 5-dibromo benzyl , 3, 4, 5-trichloro benzyl , 3, 5-dichloro -4- hydroxy benzyl , 3, 5-dimethyl -4- hydroxy benzyl , 2- methoxy -3- chloro benzyl , 2- methylbenzyl , 2- (2 -methylphenyl) ethyl , 1- (3 -methylphenyl) ethyl , 3- (4 -methylphenyl) propyl , 4- (2 -ethyl phenyl) butyl , 5- (3 -propyl phenyl) pentyl , 6- (4 -butyl phenyl) hexyl , 2- (2 -pentyl phenyl) ethyl , 1- (3 -hexyl phenyl) ethyl , 3- (3 and 4 -dimethylphenyl) propyl , 2- (3, 4 and 5 -trimethyl phenyl) ethyl , (2 -methyl

メチルフェニル)プロピル、4-(2-エチルフェニル)ブチル、5-(3-プロピルフェニル)ペンチル、6-(4-ブチルフェニル)ヘキシル、2-(2-ペンチルフェニル)エチル、1-(3-ヘキシルフェニル)エチル、3-(3,4-ジメチルフェニル)プロピル、2-(3,4,5-トリメチルフェニル)エチル、(2-メチル-6-クロロフェニル)メチル、3-フェニル-2-ヒドロキシプロピル、2-フェニル-2-ヒドロキシエチル、1-フェニル-1-ヒドロキシメチル、3-(4-メチルフェニル)-3-ヒドロキシプロピル、4-(3-クロロフェニル)-4-ヒドロキシブチル、5-(2-プロモフェニル)-5-ヒドロキシペンチル、6-(4-フルオロフェニル)-6-ヒドロキシヘキシル基等のアルキル部分の炭素数が 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、該アルキル基部分に水酸基を有することのある、且つフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を 1~3 個有することのあるフェニルアルキル基を例示できる。

[0198]

フェニル環上に置換基して低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基としては、例えばフェノキシメチル、2-フェノキシエチル、1-フェノキシエチル、4-フェノキシブチル、5-フェノキシペンチル、6-フェノキシヘキシル、1,1-ジメチル-2-フェノキシエチル、2-メチル-3-フェノキシプロピル、(2-メチルフェノキシ)メチル、2-(2-メチルフェノキシ)エチル、3-フェノキシプロピル、4-(3-メチルフェノキシ)ブチル、5-(2-エチルフェノキシ)ペンチル、6-(3-プロピルフェノキシ)ヘキシル、(4-ブチルフェノキシ)メチル、2-(2-ペンチルフェノキシ)エチル、1-(3-ヘキシルフェノキシ)エチル、3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロピル、2-(3,4,5-トリメチルフェノキシ)エチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~3 個有することのあるフェノキシ基置換炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

[0199]

フェニル環上に置換基として低級アルキル基、
フェニル基、
低級アルコキシ基、
ハロゲン原子置換低級アルキル基、
置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、
ニトロ基、
低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、

-6-chlorophenyl) methyl, 3-phenyl-2-hydroxypropyl, 2-phenyl-2-hydroxyethyl, 1-phenyl-1-hydroxymethyl, 3-(4-methylphenyl)-3-hydroxypropyl, 4-(3-chlorophenyl)-4-hydroxybutyl, 5-(2-bromophenyl)-5-hydroxypentyl, 6-(4-fluorophenyl)-6-hydroxyhexyl group or other alkyl portion carbon number with straight or branched condition alkyl group of 1-6, aretimes when it possesses hydroxy group in said alkyl group portion, at same time on phenyl ring phenyl alkyl group which has fact that 1-3 it possesses the group which is chosen can be illustrated from group which becomes straight or branched condition alkyl group and halogen atom of carbon number 1~6 as substituent.

[0198]

substituent doing on phenyl ring, it can illustrate straight or branched condition alkyl group of phenoxy group substitute carbon Mathematical Formula 1~6 which has fact that 1-3 it possesses the straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as substituent on for example phenoxy methyl, 2-phenoxy ethyl, 1-phenoxy ethyl, 4-phenoxy butyl, 5-phenoxy pentyl, 6-phenoxy hexyl, 1,1-dimethyl-2-phenoxy ethyl, 2-methyl-3-phenoxy propyl, (2-methyl phenoxy) methyl, 2-(2-methyl phenoxy) ethyl, 3-phenoxy propyl, 4-(3-methyl phenoxy) butyl, 5-(2-ethyl phenoxy) pentyl, 6-(3-propyl phenoxy) hexyl, (4-butylphenoxy) methyl, 2-(2-pentyl phenoxy) ethyl, 1-(3-hexyl phenoxy) ethyl, 3-(3 and 4-dimethyl phenoxy) propyl, 2-(3,4 and 5-trimethyl phenoxy) ethyl group or other phenyl ring as phenoxy lower alkyl group which has fact that it possesses the lower alkyl group.

[0199]

On phenyl ring as substituent lower alkyl group,
phenyl group,
lower alkoxy group,
halogen atom substituted lower alkyl group,
amino group, which has times when it possesses lower alkyl group as the substituent
nitro group,
There are times when it possesses group which is chosen from the group which becomes lower alkanoyl group substituted

原子なる群より選ばれた基を有することがあり、
且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロ
ゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アル
カノイル基としては、

例えば、

2-フェノキシアセチル、
2-フェノキシプロピオニル、
3-フェノキシプロピオニル、
2-フェノキシブチリル、
4-フェノキシブチリル、
2,2-ジメチル-3-フェノキシプロピオニル、
5-フェノキシペンタノイル、
6-フェノキシヘキサノイル、
2-(2-クロロフェノキシ)アセチル、
2-(3-クロロフェノキシ)アセチル、
2-(4-クロロフェノキシ)アセチル、
2-(2-フルオロフェノキシ)アセチル、
2-(3-フルオロフェノキシ)アセチル、
3-(4-フルオロフェノキシ)プロピオニル、
2-(2-ブロモフェノキシ)プロピオニル、
4-(3-ブロモフェノキシ)ブチリル、
5-(4-ブロモフェノキシ)ペンタノイル、
6-(2-ヨードフェノキシ)ヘキサノイル、
2-(3-ヨードフェノキシ)アセチル、
3-(4-ヨードフェノキシ)プロピオニル、
4-(3,4-ジクロロフェノキシ)ブチリル、
2-(3,4-ジクロロフェノキシ)アセチル、
2-(2,6-ジクロロフェノキシ)アセチル、
2-(2,3-ジクロロフェノキシ)アセチル、
2-(2,4-ジクロロフェノキシ)アセチル、
2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)アセチル、
3-(3,5-ジブロモフェノキシ)プロピオニル、
2-(3,4,5-トリクロロフェノキシ)アセチル、
2-(2-メチルフェノキシ)アセチル、
2-(3-メチルフェノキシ)アセチル、
2-(4-メチルフェノキシ)アセチル、

amino group and halogen atom ,

At same time in lower alkanoyl portion as phenoxy lower
alkanoyl group which has fact that it possesses halogen atom
as substituent ,

for example

2 -phenoxy acetyl ,
2 -phenoxy propanoyl ,
3 -phenoxy propanoyl ,
2 -phenoxy butyryl ,
4 -phenoxy butyryl ,
2 and 2 -dimethyl -3- phenoxy propanoyl ,
5 -phenoxy pentanoyl ,
6 -phenoxy hexanoyl ,
2 - (2 -chlorophenoxy) acetyl ,
2 - (3 -chlorophenoxy) acetyl ,
2 - (4 -chlorophenoxy) acetyl ,
2 - (2 -fluorophenoxy) acetyl ,
2 - (3 -fluorophenoxy) acetyl ,
3 - (4 -fluorophenoxy) propanoyl ,
2 - (2 -bromo phenoxy) propanoyl ,
4 - (3 -bromo phenoxy) butyryl ,
5 - (4 -bromo phenoxy) pentanoyl ,
6 - (2 -iodo phenoxy) hexanoyl ,
2 - (3 -iodo phenoxy) acetyl ,
3 - (4 -iodo phenoxy) propanoyl ,
4 - (3 and 4 -dichloro phenoxy) butyryl ,
2 - (3 and 4 -dichloro phenoxy) acetyl ,
2 - (2 and 6 -dichloro phenoxy) acetyl ,
2 - (2 and 3 -dichloro phenoxy) acetyl ,
2 - (2 and 4 -dichloro phenoxy) acetyl ,
2 - (3 and 4 -difluoro phenoxy) acetyl ,
3 - (3 and 5 -dibromo phenoxy) propanoyl ,
2 - (3, 4 and 5 -trichlorophenoxy) acetyl ,
2 - (2 -methyl phenoxy) acetyl ,
2 - (3 -methyl phenoxy) acetyl ,
2 - (4 -methyl phenoxy) acetyl ,

3-(2-エチルフェノキシ)プロピオニル、
 2-(3-エチルフェノキシ)プロピオニル、
 4-(4-エチルフェノキシ)ブチリル、
 5-(4-イソプロピルフェノキシ)ペンタノイル、
 6-(3-ブチルフェノキシ)ヘキサノイル、
 3-(4-ペンチルフェノキシ)プロピオニル、
 2-(4-ヘキシルフェノキシ)アセチル、
 2-(3,4-ジメチルフェノキシ)アセチル、
 2-(3,4-ジエチルフェノキシ)アセチル、
 2-(2,4-ジメチルフェノキシ)アセチル、
 2-(2,5-ジメチルフェノキシ)アセチル、
 2-(2,6-ジメチルフェノキシ)アセチル、
 2-(3,4,5-トリメチルフェノキシ)アセチル、
 2-(3-クロロ-4-メチルフェノキシ)アセチル、
 2-(3-ジメチルアミノフェノキシ)アセチル、
 2-(3-ニトロフェノキシ)アセチル、
 2-(2-メトキシフェノキシ)アセチル、
 2-(3-メトキシフェノキシ)アセチル、
 2-(4-メトキシフェノキシ)アセチル、
 2-(2-フェニルフェノキシ)アセチル、
 2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)アセチル、
 3-(2-アミノフェノキシ)プロピオニル、
 4-(4-エチルアミノフェノキシ)ブチリル、5-(2,3-ジ
 メトキシフェノキシ)ペンタノイル、6-(2,4,6-トリメ
 トキシフェノキシ)ヘキサノイル、3-(2-エトキシフェ
 ノキシ)プロピオニル、4-(3-プロポキシフェノキシ)
 プロピオニル、2-(4-ブトキシフェノキシ)アセチ
 ル、3-(4-ペンチルオキシフェノキシ)プロピオニ
 ル、4-(4-ヘキシルオキシフェノキシ)ブチリル、3-
 (2-ニトロフェノキシ)プロピオニル、4-(4-ニトロフ
 エノキシ)ブチリル、3-(3-フェニルフェノキシ)プロ
 ピオニル、4-(4-フェニルフェノキシ)ブチリル、5-
 [3-(2,2,2-トリクロロエチル)フェノキシ]ペンタノイ
 ル、6-[4-(5-ブロモヘキシル)フェノキシ]ヘキサノ
 イル、2-(4-フェニル-2-メトキシフェノキシ)アセチ
 ル、2-(2-フェニル-4-メチルフェノキシ)アセチル、
 2-(2,4,6-トリニトロフェノキシ)アセチル、2-(2,4-ジ
 ニトロフェノキシ)アセチル、2-(3-フェニル-2-ジメ
 チルアミノフェノキシ)アセチル、2-フェノキシ-2,2-
 ジフルオロアセチル、3-(3-ジメチルアミノフェノキ
 シ)-3-ブロモプロピオニル、4-(3-ニトロフェノキ
 シ)-3,4,4-トリクロロブチリル、5-(2-メトキシフェノ

3 - (2 -ethyl phenoxy) propanoyl ,
 2 - (3 -ethyl phenoxy) propanoyl ,
 4 - (4 -ethyl phenoxy) butyryl ,
 5 - (4 -isopropyl phenoxy) pentanoyl ,
 6 - (3 -butylphenoxy) hexanoyl ,
 3 - (4 -pentyl phenoxy) propanoyl ,
 2 - (4 -hexyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (3 and 4 -dimethyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (3 and 4 -diethyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (2 and 4 -dimethyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (2 and 5 -dimethyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (2 and 6 -dimethyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (3, 4 and 5 -trimethyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (3 -chloro -4- methyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (3 -dimethylamino phenoxy) acetyl ,
 2 - (3 -nitro phenoxy) acetyl ,
 2 - (2 -methoxy phenoxy) acetyl ,
 2 - (3 -methoxy phenoxy) acetyl ,
 2 - (4 -methoxy phenoxy) acetyl ,
 2 - (2 -phenyl phenoxy) acetyl ,
 2 - (2 -trifluoromethyl phenoxy) acetyl ,
 3 - (2 -aminophenoxy) propanoyl ,
 4 - (4 -ethylamino phenoxy) butyryl , 5- (2 and 3 -dimethoxy
 phenoxy) pentanoyl , 6- (2, 4 and 6 -trimethoxy phenoxy)
 hexanoyl , 3- (2 -ethoxy phenoxy) propanoyl , 4- (3 -propoxy
 phenoxy) propanoyl , 2- (4 -butoxy phenoxy) acetyl , 3- (4
 -pentyloxy phenoxy) propanoyl , 4- (4 -hexyloxy phenoxy)
 butyryl , 3- (2 -nitro phenoxy) propanoyl , 4- (4 -nitro
 phenoxy) butyryl , 3- (3 -phenyl phenoxy) propanoyl , 4- (4
 -phenyl phenoxy) butyryl , 5- {3 - (2, 2 and 2 -trichloroethyl)
 phenoxy } pentanoyl , 6- {4 - (5 -bromo hexyl) phenoxy }
 hexanoyl , 2- (4 -phenyl -2- methoxy phenoxy) acetyl , 2- (2
 -phenyl -4- methyl phenoxy) acetyl , 2- (2, 4 and 6 -tri nitro
 phenoxy) acetyl , 2- (2 and 4 -di nitro phenoxy) acetyl , 2- (3
 -phenyl -2- dimethylamino phenoxy) acetyl , 2- phenoxy -2,
 2- difluoro acetyl , 3- (3 -dimethylamino phenoxy) - 3
 -bromo propanoyl , 4- (3 -nitro phenoxy) - 3, 4 and
 4-trichloro butyryl , 5- (2 -methoxy phenoxy) - 5 -iodo
 pentanoyl , 2- (2 and 6 -dichloro phenoxy) - 2 -chloroacetyl ,
 2- (4 -methyl phenoxy) - 2 and 2 -difluoro acetyl , 2- (2
 -phenyl phenoxy) - 2, 2 -difluoro acetyl , 6- (2 -phenyl
 phenoxy) - 6 -bromo hexanoyl , 2- on (2 -acetyl amino

キシ)-5-ヨードペンタノイル、2-(2,6-ジクロロフェノキシ)-2-クロロアセチル、2-(4-メチルフェノキシ)-2,2-ジフルオロアセチル、2-(2-フェニルフェノキシ)-2,2-ジフルオロアセチル、6-(2-フェニルフェノキシ)-6-ブロモヘキサノイル、2-(2-アセチルアミノフェノキシ)アセチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、フェニル基、炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基、ニトロ基、炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を 1~3 個有することのあるアルカノイル部分の炭素数が 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有することのあるフェノキシアルカノイル基を例示できる。

【0200】

置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基としては、例えば、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、tert-ブチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル、ヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル、ジペンチルアミノカルボニル、ジヘキシルアミノカルボニル、N-メチル-N-エチルアミノカルボニル、N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル、N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル、N-メチル-N-ヘキシルアミノカルボニル、N-エチル-N-(ピリジルメチル)アミノカルボニル、N-エチル-N-ベンジルアミノカルボニル、ベンジルアミノカルボニル、(2-フェニルエチル)アミノカルボニル、(1-フェニルエチル)アミノカルボニル、(3-フェニルプロピル)アミノカルボニル、(4-フェニルブチル)アミノカルボニル、(5-フェニルペンチル)アミノカルボニル、(6-フェニルヘキシル)アミノカルボニル、N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル、ピリジルメチルアミノカルボニル、(2-ピリジルエチル)アミノカルボニル、(3-ピリジルプロピル)アミノカルボニル、(4-ピリジルブチル)アミノカルボニル、(5-ピリジルペンチル)アミノカルボニル、(6-ピリジルヘキシル)アミノカルボニル、N-(ピリジルメチル)-N-ベンジルアミノカルボニル、N-メチル-N-(ピリジルメチル)アミノカルボニル基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖

phenoxy) acetyl group or other phenyl ring as substituent from straight or branched condition alkanoyl group substituted amino group of amino group, nitro group, carbon number 1~6 which has times when 1 - 2 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as straight or branched condition alkyl group, substituent of carbon number 1~6 which 1 - 3 possesses halogen atom as the straight or branched condition alkoxy group, substituent of straight or branched condition alkyl group, phenyl group, carbon number 1~6 of carbon number 1~6 and group which consists of halogen atom group which is chosen 1 - 3 carbon number of alkanoyl portion which has times when it possesses with the straight or branched condition alkanoyl group of 2 - 6, at same time can illustrate the phenoxy alkanoyl group which has fact that 1 - 3 it possesses halogen atom as the substituent to lower alkanoyl portion.

【0200】

As amino carbonyl group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group, pyridyl lower alkyl group and phenyl lower alkyl group as the substituent, pyridyl alkyl group where straight or branched condition alkyl group, alkyl portion of carbon number 1~6 is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 for example amino carbonyl, methylamino carbonyl, ethylamino carbonyl, propyl amino carbonyl, isopropyl amino carbonyl, butyl amino carbonyl, t-butyl amino carbonyl, pentyl amino carbonyl, hexyl amino carbonyl, dimethylamino carbonyl, diethyl amino carbonyl, dipropyl amino carbonyl, dibutyl amino carbonyl, di pentyl amino carbonyl, di hexyl amino carbonyl, N-methyl-N-ethylamino carbonyl, N-ethyl-N-propyl amino carbonyl, N-methyl-N-butyl amino carbonyl, N-methyl-N-hexyl amino carbonyl, N-ethyl-N-(pyridyl methyl) amino carbonyl, N-ethyl-N-benzylamino carbonyl, benzylamino carbonyl, (2-phenylethyl) amino carbonyl, (1-phenylethyl) amino carbonyl, (3-phenyl propyl) amino carbonyl, (4-phenyl butyl) amino carbonyl, (5-phenyl pentyl) amino carbonyl, (6-phenyl hexyl) amino carbonyl, N-methyl-N-benzylamino carbonyl, pyridyl methylamino carbonyl, (2-pyridyl ethyl) amino carbonyl, (3-pyridyl propyl) amino carbonyl, (4-pyridyl butyl) amino carbonyl, (5-pyridyl pentyl) amino carbonyl, (6-pyridyl hexyl) amino carbonyl, N-(pyridyl methyl)-N-benzylamino carbonyl, N-methyl-N-as (pyridyl methyl) amino carbonyl group or other substituent and amino carbonyl group which has fact that 1 - 2 it possesses group which is chosen can be illustrated from group which becomes phenyl alkyl group where alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon

又は分枝鎖状アルキル基、アルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基及びアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基なる群より選ばれた基を 1~2 個有することのあるアミノカルボニル基を例示できる。

【0201】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、2-メチルベンゾイル、3-メチルベンゾイル、4-メチルベンゾイル、2-エチルベンゾイル、3-プロピルベンゾイル、4-ブチルベンゾイル、2-ペンチルベンゾイル、3-ヘキシルベンゾイル、3,4-ジメチルベンゾイル、3,4,5-トリメチルベンゾイル基等のフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~3 個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0202】

シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル基等の炭素数 3~8 のシクロアルキル基を例示できる。

【0203】

低級アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基を例示できる。

【0204】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、4-フェニルブチリル、2,2-ジメチル-3-フェニルプロピオニル、5-フェニルペンタノイル、6-フェニルヘキサノイル、2-(2-メチルフェニル)アセチル、2-(3-メチルフェニル)アセチル、2-(4-メチルフェニル)アセチル、3-(2-エチルフェニル)プロピオニル、2-(3-エチルフェニル)プロピオニル、4-(4-エチルフェニル)ブチリル、5-(4-イソプロピルフェニル)ペンタノイル、6-(3-ブチルフェニル)ヘキサノイル、3-(4-ペンチルフェニル)プロピオニル、2-(4-ヘキシルフェニル)アセチル、2-(3,4-ジメチルフェニル)アセチル、2-(3,4-ジエチルフェニル)アセチル、2-(2,4-ジメチルフェニル)アセチル、2-(2,5-ジメチルフェニル)アセチル、2-(2,6-ジメチルフェニル)アセチル、2-(3,4,5-トリメチルフェニル)アセチル基等のフェニル環上に置換基と

number 1~6.

【0201】

On phenyl ring benzoyl group which has fact that 1 - 3 it possesses the straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as substituent can be illustrated on for example benzoyl , 2- methyl benzoyl , 3- methyl benzoyl , 4- methyl benzoyl , 2- ethyl benzoyl , 3- propyl benzoyl , 4- butyl benzoyl , 2- pentyl benzoyl , 3- hexyl benzoyl , 3, 4- dimethyl benzoyl , 3, 4, 5-trimethyl benzoyl group or other phenyl ring as benzoyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent .

【0202】

As cycloalkyl group , cycloalkyl group of for example cyclopropyl , cyclobutyl , cyclopentyl , cyclohexyl , cycloheptyl , cyclooctyl group or other carbon number 3~8 can be illustrated.

【0203】

As lower alkyl thio group , straight or branched condition alkyl thio group of for example methylthio , ethyl thio , propyl thio , isopropyl thio , butyl thio , t- butyl thio , pentyl thio , hexylthio group or other carbon number 1~6 can be illustrated.

【0204】

On phenyl ring as phenyl lower alkanoyl group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent , There are times when 1 - 3 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as substituent on for example 2- phenyl acetyl , 3- phenyl propanoyl , 4- phenyl butyryl , 2, 2- dimethyl -3- phenyl propanoyl , 5-phenyl pentanoyl , 6-phenyl hexanoyl , 2- (2 -methylphenyl) acetyl , 2- (3 -methylphenyl) acetyl , 2- (4 -methylphenyl) acetyl , 3- (2 -ethyl phenyl) propanoyl , 2- (3 -ethyl phenyl) propanoyl , 4- (4 -ethyl phenyl) butyryl , 5- (4 -isopropyl phenyl) pentanoyl , 6- (3 -butyl phenyl) hexanoyl , 3- (4 -pentyl phenyl) propanoyl , 2- (4 -hexyl phenyl) acetyl , 2- (3 and 4 -dimethylphenyl) acetyl , 2- (3 and 4 -diethyl phenyl) acetyl , 2- (2 and 4 -dimethylphenyl) acetyl , 2- (2 and 5 -dimethylphenyl) acetyl , 2- (2 and 6 -dimethylphenyl) acetyl , 2- (3, 4 and 5 - [torimechirifeniru]) acetyl group or other phenyl ring , phenyl alkanoyl group where the alkanoyl portion is straight or branched condition alkanoyl group of

して炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~3 個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェニルアルカノイル基を例示できる。

【0205】

ハロゲン原子置換低級アルコキシ基としては、例えば、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、フルオロメトキシ、ヨードメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジブロモメトキシ、2-クロロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、3-ブロモプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、4,4,4-トリクロロプロポキシ、4-フルオロプロポキシ、5-クロロペンチルオキシ、3-クロロ-2-メチルプロポキシ、5-ブロモヘキシルオキシ、5,6-ジクロロヘキシルオキシ等の置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0206】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基としては、例えば、アミノメトキシ、2-アミノエトキシ、1-アミノエトキシ、3-アミノプロポキシ、4-アミノプロポキシ、5-アミノペンチルオキシ、6-アミノヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-アミノエトキシ、2-メチル-3-アミノプロポキシ、メチルアミノメトキシ、1-エチルアミノエトキシ、2-プロピルアミノエトキシ、3-イソプロピルアミノプロポキシ、4-イソプロピルアミノプロポキシ、4-ブチルアミノプロポキシ、4-tert-ブチルアミノプロポキシ、5-ペンチルアミノペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ、ジメチルアミノメトキシ、2-ジエチルアミノエトキシ、2-ジメチルアミノエトキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メトキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エトキシ等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基を有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0207】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基、
低級アルコキシ基、
フェニル低級アルコキシ基、
水酸基、
低級アルカノイルオキシ基、
ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、

carbon number 2~6 can be illustrated.

【0205】

As halogen atom substitution lower alkoxy group, straight or branched condition alkoxy group of the carbon number 1~6 which 1 - 3 possesses halogen atom as for example trifluoromethoxy, trichloro methoxy, chloro methoxy, bromo methoxy, fluoro methoxy, iodo methoxy, difluoro methoxy, dibromo methoxy, 2- chloro ethoxy, 2, 2, 2- trifluoro ethoxy, 2, 2, 2- trichloro ethoxy, 3- bromo propoxy, 3- chloro propoxy, 2, 3- dichloro propoxy, 4, 4, 4- trichloro butoxy, 4- fluoro butoxy, 5-chloro pentyloxy, 3- chloro -2- methyl propoxy, 5-bromo hexyloxy, 5, 6-dichloro hexyloxy group or other substituent can be illustrated.

【0206】

As amino substitution lower alkoxy group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent, 1 - 2 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as for example amino methoxy, 2- amino ethoxy, 1- amino ethoxy, 3- amino propoxy, 4- amino butoxy, 5-amino pentyloxy, 6-amino hexyloxy, 1, 1- dimethyl -2- amino ethoxy, 2- methyl -3- amino propoxy, methylamino methoxy, 1- ethylamino ethoxy, 2- propyl amino ethoxy, 3- isopropyl amino propoxy, 4- isopropyl amino butoxy, 4- butyl amino butoxy, 4- t- butyl amino butoxy, 5-pentyl amino pentyloxy, 6-hexyl amino hexyloxy, dimethylamino methoxy, 2- diethyl amino ethoxy, 2- dimethylamino ethoxy, (N- ethyl -N- propyl amino) methoxy, 2- (N- methyl -N- hexyl amino) ethoxy group or other substituent straight or branched condition alkoxy group of carbon number 1~6 which possesses amino group which has times when can be illustrated.

【0207】

On phenyl ring as substituent lower alkyl group ,
lower alkoxy group ,
phenyl lower alkoxy group ,
hydroxy group ,
lower alkanoyl oxy group ,
halogen atom substitution lower alkoxy group ,

ニトロ基、

置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、

フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基としては、

例えば、

フェニル、

2-メチルフェニル、

3-メチルフェニル、

4-メチルフェニル、

2-エチルフェニル、

3-プロピルフェニル、

4-ブチルフェニル、

2-ペンチルフェニル、

3-ヘキシルフェニル、

3,4-ジメチルフェニル、

3,4,5-トリメチルフェニル、

2-メトキシフェニル、

3-メトキシフェニル、

4-メトキシフェニル、

2-エトキシフェニル、

4-エトキシフェニル、

3-プロポキシフェニル、

4-プロポキシフェニル、

4-ブトキシフェニル、

2-ペンチルオキシフェニル、

3-ヘキシルオキシフェニル、

2,4-ジメトキシフェニル、

3,4-ジエトキシフェニル、

3,4,5-トリメトキシフェニル、

2-ヒドロキシフェニル、

3-ヒドロキシフェニル、

4-ヒドロキシフェニル、

2,4-ジヒドロキシフェニル、

nitro group ,

amino group , which has times when it possesses lower alkanoyl group as the substituent

As phenyl group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes amino substitution lower alkoxy group which has times when it possesses lower alkyl group as phenyl group and substituent ,

for example

phenyl ,

2 -methylphenyl ,

3 -methylphenyl ,

4 -methylphenyl ,

2 -ethyl phenyl ,

3 -propyl phenyl ,

4 -butyl phenyl ,

2 -pentyl phenyl ,

3 -hexyl phenyl ,

3 and 4 -dimethylphenyl ,

3, 4 and 5 -trimethyl phenyl ,

2 -methoxyphenyl ,

3 -methoxyphenyl ,

4 -methoxyphenyl ,

2 -ethoxy phenyl ,

4 -ethoxy phenyl ,

3 -propoxy phenyl ,

4 -propoxy phenyl ,

4 -butoxy phenyl ,

2 -pentyloxy phenyl ,

3 -hexyloxy phenyl ,

2 and 4 -dimethoxy phenyl ,

3 and 4 -diethoxy phenyl ,

3, 4 and 5 -trimethoxy phenyl ,

2 -hydroxyphenyl ,

3 -hydroxyphenyl ,

4 -hydroxyphenyl ,

2 and 4 -dihydroxy phenyl ,

3,4-ジヒドロキシフェニル、	3 and 4 -dihydroxy phenyl ,
2,4,6-トリヒドロキシフェニル、	2, 4 and 6 -trihydroxy phenyl ,
2-アセチルオキシフェニル、	2 -acetyl oxy phenyl ,
3-プロピオニルオキシフェニル、	3 -propanoyl oxy phenyl ,
2-ベンジルオキシフェニル、	2 -benzyloxy phenyl ,
3-ベンジルオキシフェニル、	3 -benzyloxy phenyl ,
4-ベンジルオキシフェニル、	4 -benzyloxy phenyl ,
2-(2-フェニルエトキシ)フェニル、	2 - (2 -phenyl ethoxy) phenyl ,
3-(3-フェニルプロポキシ)フェニル、	3 - (3 -phenyl propoxy) phenyl ,
4-(4-フェニルブトキシ)フェニル、	4 - (4 -phenyl butoxy) phenyl ,
3-(1-フェニルエトキシ)フェニル、	3 - (1 -phenyl ethoxy) phenyl ,
2-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル、	2 - (5 -phenyl pentyloxy) phenyl ,
3-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル、	3 - (6 -phenyl hexyloxy) phenyl ,
2,4-ジベンジルオキシフェニル、	2 and 4 -dibenzyl oxy phenyl ,
3,4-ジベンジルオキシフェニル、	3 and 4 -dibenzyl oxy phenyl ,
3,4,5-トリベンジルオキシフェニル、	3, 4 and 5 -tri benzyloxy phenyl ,
4-ブチリルオキシフェニル、	4 -butyryl oxy phenyl ,
2-ペンタノイルオキシフェニル、	2 -pentanoyl oxy phenyl ,
4-ヘキサノイルオキシフェニル、	4 -hexanoyl oxy phenyl ,
2,4-ジアセチルオキシフェニル、	2 and 4 -diacetyl oxy phenyl ,
2,6-ジアセチルオキシフェニル、	2 and 6 -diacetyl oxy phenyl ,
3,4,5-トリアセチルオキシフェニル、	3, 4 and 5 -triacetyl oxy phenyl ,
2-トリフルオロメトキシフェニル、	2 -trifluoromethoxy phenyl ,
3-(2-クロロエトキシ)フェニル、	3 - (2 -chloro ethoxy) phenyl ,
2-(3-ブロモプロポキシ)フェニル、	2 - (3 -bromo propoxy) phenyl ,
4-ヨードメトキシフェニル、	4 -iodo methoxyphenyl ,
2-(2,3-ジクロロプロポキシ)フェニル、	2 - (2 and 3 -dichloro propoxy) phenyl ,
3-(4-フルオロブトキシ)フェニル、	3 - (4 -fluoro butoxy) phenyl ,
4-(3-クロロ-2-メチルプロポキシ)フェニル、	4 - (3 -chloro -2- methyl propoxy) phenyl ,
2-(5-ブロモヘキシルオキシ)フェニル、	2 - (5 -bromo hexyloxy) phenyl ,
3-(5,6-ジクロロヘキシルオキシ)フェニル、	3 - (5 and 6 -dichloro hexyloxy) phenyl ,
4-(2,2,2-トリクロロエトキシ)フェニル、2,4-ビストリフルオロメトキシフェニル、2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル、2-アミノメトキシフェニル、3-(1-アミノエトキシ)フェニル、4-(3-アミノプロポキシ)フェニル、2-(4-アミノブトキシ)フェニル、3-(5-アミノペンチルオキシ)フェニル、4-(6-アミノヘキ	4 - On (2, 2 and 2 -trichloro ethoxy) phenyl , 2, 4- bis trifluoromethoxy phenyl , 2, 4, 6-tri (trifluoromethoxy) phenyl , 2- amino methoxyphenyl , 3- (1 -amino ethoxy) phenyl , 4- (3 -amino propoxy) phenyl , 2- (4 -amino butoxy) phenyl , 3- (5 -amino pentyloxy) phenyl , 4- (6 -amino hexyloxy) phenyl , 2- methylamino methoxyphenyl , 3- (2

シルオキシ)フェニル、2-メチルアミノメトキシフェニル、3-(2-プロピルアミノエトキシ)フェニル、2-(3-イソプロピルアミノプロポキシ)フェニル、4-(4-ブチルアミノブトキシ)フェニル、2-(5-ペンチルアミノペンチルオキシ)フェニル、3-(6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ)フェニル、4-ジメチルアミノメトキシフェニル、2-(N-エチル-N-プロピルアミノメトキシ)フェニル、2-メチル-4-メトキシフェニル、2-メチル-6-ヒドロキシフェニル、4-メチル-2-(3-プロモプロポキシ)フェニル、4-メトキシ-2-(3-イソプロピルアミノプロポキシ)フェニル、2-フェニルフェニル、3-フェニルフェニル、4-フェニルフェニル、2-ニトロフェニル、3-ニトロフェニル、4-ニトロフェニル、2,3-ジニトロフェニル、2,4,6-トリニトロフェニル、2-アミノエチル、3-アミノフェニル、4-アミノフェニル、2,4-ジアミノフェニル、3,4,5-トリアミノフェニル、4-アセチルアミノフェニル、2-プロピオニルアミノフェニル、3-ブチルアミノフェニル、4-ペンタノイルアミノフェニル、4-ヘキサノイルアミノフェニル、2,3-ジアセチルアミノフェニル、2,4,6-トリアセチルアミノフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、水酸基、炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基、置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、ニトロ基、置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基、及び置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基を有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群より選ばれた基を 1~3 個有することのあるフェニル基を例示できる。

[0208]

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基としては、例えば、アニリノメチル、2-アニリノエチル、1-アニリノエチル、3-アニリノプロピル、4-アニリノブチル、1,1-ジメチル-2-アニリノエチル、5-アニリノペンチル、6-アニリノヘキシル、2-メチル-3-アニリノプロピル、(2-メチルアニリノ)メチル、2-(2-メチルアニリノ)エチル、1-(3-メチルアニリノ)エチル、3-(4-メチルアニリノ)プロピル、4-(2-エチルアニリノ)ブチル、5-(3-プロピルアニリノ)ペンチル、6-(4-ブチルアニリノ)ヘキシル、2-(2-ペンチルアニリノ)エチル、1-(3-ヘキシルアニリノ)エチル、3-(3,4-ジメチルアニリノ)プロピル、2-(3,4,5-トリメチルアニリノ)エチル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~3 個有する

-propyl amino ethoxy) phenyl , 2- (3 -isopropyl amino propoxy) phenyl , 4- (4 -butyl amino butoxy) phenyl , 2- (5 -pentyl amino pentyloxy) phenyl , 3- (6 -hexyl amino hexyloxy) phenyl , 4- dimethylamino methoxyphenyl , 2- (N-ethyl -N- propyl amino methoxy) phenyl , 2- methyl -4- methoxyphenyl , 2- methyl -6-hydroxyphenyl , 4- methyl -2- (3 -bromo propoxy) phenyl , 4- methoxy -2- (3 -isopropyl amino propoxy) phenyl , 2- phenyl phenyl , 3- phenyl phenyl , 4- phenyl phenyl , 2- nitrophenyl , 3- nitrophenyl , 4- nitrophenyl , 2, 3- di nitrophenyl , 2, 4, 6-tri nitrophenyl , 2- aminoethyl , 3- amino phenyl , 4- amino phenyl , 2, 4- diamino phenyl , 3, 4, 5-triamino phenyl , 4- acetyl amino phenyl , 2- propanoyl amino phenyl , 3- butyryl amino phenyl , 4- pentanoyl amino phenyl , 4- hexanoyl amino phenyl , 2, 3- diacetyl amino phenyl , 2, 4, 6-triacetyl amino phenyl group or other phenyl ring as straight or branched condition alkanoyl oxy group , substituent of straight or branched condition alkoxy group , hydroxy group , carbon number 1~6 of straight or branched condition alkyl group , carbon number 1~6 of carbon number 1~6 as substituent halogen atom 1 - 3 phenyl group which has fact that 1 - 3 it possesses group which is chosen can be illustrated from group which becomes straight or branched condition alkoxy group of carbon number 1~6 which possesses amino group which has the times when 1 - 2 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as amino group , phenyl group , and substituent which have times when it possesses the straight or branched condition alkanoyl group of carbon number 1~6 as straight or branched condition alkoxy group , nitro group , substituent of the carbon number 1~6 which it possesses.

[0208]

On phenyl ring as anilino lower alkyl group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent , for example anilino methyl , 2- anilino ethyl , 1- anilino ethyl , 3- anilino propyl , 4- anilino butyl , 1, 1- dimethyl -2- anilino ethyl , 5-anilino pentyl , 6-anilino hexyl , 2- methyl -3- anilino propyl , (2 -methyl anilino) methyl , 2- (2 -methyl anilino) ethyl , 1- (3 -methyl anilino) ethyl , 3- (4 -methyl anilino) propyl , 4- (2 -ethyl anilino) butyl , 5- (3 -propyl anilino) pentyl , 6- (4 -butyl anilino) hexyl , 2- (2 -pentyl anilino) ethyl , 1- (3 -hexyl anilino) ethyl , 3- (3 and 4 -dimethyl anilino) propyl , 2- (3, 4 and 5 -trimethyl anilino) ethyl group or other alkyl portion with the straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6, At same time anilino alkyl group which has fact that 1 - 3 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as substituent can be illustrated on phenyl ring .

ことのあるアニリノアルキル基を例示できる。

【0209】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、

低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基としては、

例えば、

フェニルメトキシ、

2-フェニルエトキシ、

1-フェニルエトキシ、

3-フェニルプロポキシ、

4-フェニルブトキシ、

5-フェニルペンチルオキシ、

6-フェニルヘキシルオキシ、

1,1-ジメチル-2-フェニルエトキシ、

2-メチル-3-フェニルプロポキシ、

(2-クロロフェニル)メトキシ、

(2-ブロモフェニル)メトキシ、

2-(4-フルオロフェニル)エトキシ、

1-(4-ブロモフェニル)エトキシ、3-(3-ブロモフェニル)プロポキシ、4-(4-クロロフェニル)ブトキシ、5-(2-ヨードフェニル)ペンチルオキシ、6-(3-ヨードフェニル)ヘキシルオキシ、(2,6-ジクロロフェニル)メトキシ、(2,3-ジクロロフェニル)メトキシ、(2,4-ジクロロフェニル)メトキシ、(3,4-ジフルオロフェニル)メトキシ、(3,4,5-トリクロロフェニル)メトキシ、(2-メトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(3-エトキシカルボニルフェニル)メトキシ、2-(4-イソプロポキシカルボニルフェニル)エトキシ、3-(2-ブトキシカルボニルフェニル)プロポキシ、4-(3-ペンチルオキシカルボニルフェニル)ブトキシ、5-(4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル)ペンチルオキシ、6-(2-メトキシカルボニルフェニル)ヘキシルオキシ、(2,4-ジメトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(2,4,6-トリエトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(2-カルバモイルフェニル)メトキシ、2-(3-メチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、1-(4-エチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、3-(2-イソプロピルアミノカルボニルフェニル)プロポキシ、4-(3-ブチルアミノカルボニルフェニル)ブトキシ、

[0209]

On phenyl ring as substituent halogen atom ,

As lower alkoxy carbonyl group and substituent from group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group and the substituent as phenyl lower alkoxy group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes amino carbonyl group which has the times when it possesses group which is chosen,

for example

phenyl methoxy ,

2 -phenyl ethoxy ,

1 -phenyl ethoxy ,

3 -phenyl propoxy ,

4 -phenyl butoxy ,

5 -phenyl pentyloxy ,

6 -phenyl hexyloxy ,

1 and 1 -dimethyl -2- phenyl ethoxy ,

2 -methyl -3- phenyl propoxy ,

(2 -chlorophenyl) methoxy ,

(2 -bromophenyl) methoxy ,

2 - (4 -fluorophenyl) ethoxy ,

On N- propyl -N- (5 -pentyl amino pentyl) amino carbonyl *phenyl } propoxy , { 2 - {N- methyl -N- (2 -diethyl aminoethyl) amino carbonyl } phenyl } methoxy , { 2 - {N, N- bis (diethyl aminoethyl) amino carbonyl } phenyl } methoxy , 4- { 3 - (N- ethyl -N- propyl amino) methylamino carbonyl phenyl } butoxy , 5- { 4 - {N- { 2 - (N- methyl -N- hexyl amino) ethyl } -N- ethylamino carbonyl } phenyl } pentyloxy , 6- { 4 -chloro -2- {N- butyl -N- (6 -hexyl amino hexyl) amino carbonyl } phenyl } hexyloxy , { 2 -bromo -4- (N- hexyl -N- dimethylamino methyl) amino carbonyl phenyl } methoxy , (2 -methoxycarbonyl -3- chlorophenyl) methoxy group or other phenyl ring as substituent as straight or branched condition alkyl group and substituent of carbon number 1~6 as straight or branched condition alkoxy carbonyl group and substituent of halogen atom , carbon number 1~6 straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 1 - 2 From group which becomes straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 which possesses amino group which has times when it possesses thereare times when 1 - 3 it possesses group which is chosen from the group which becomes amino carbonyl group which has times when

5-(4-ペンチルアミノカルボニルフェニル)ペンチルオキシ、6-(2-ヘキシルアミノカルボニルフェニル)ヘキシルオキシ、(2-ジメチルアミノカルボニルフェニル)メトキシ、2-(3-ジブチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、1-(4-ジヘキシルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、3-[2-(N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル)フェニル]プロポキシ、(2-アミノメチルアミノカルボニルフェニル)メトキシ、2-[3-(2-アミノエチルアミノカルボニル)フェニル]エトキシ、3-[4-(3-アミノプロピルアミノカルボニル)フェニル]プロポキシ、4-[2-(4-アミノブチルアミノカルボニル)フェニル]ブトキシ、5-[3-(5-アミノペンチルアミノカルボニル)フェニル]ペンチルオキシ、6-[4-(6-アミノヘキシルアミノカルボニル)フェニル]ヘキシルオキシ、[2-(N-メチル-N-メチルアミノメチル)アミノカルボニルフェニル]メトキシ、2-[3-(3-イソプロピルアミノプロピルアミノカルボニル)フェニル]エトキシ、3-[4-(N-プロピル-N-(5-ペンチルアミノペンチル)アミノカルボニル)フェニル]プロポキシ、{2-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル]フェニル}メトキシ、{2-[N,N-ビス(ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル]フェニル}メトキシ、4-[3-(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチルアミノカルボニルフェニル]ブトキシ、5-[4-{N-[2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル]-N-エチルアミノカルボニル}フェニル]ペンチルオキシ、6-[4-クロロ-2-(N-ブチル-N-(6-ヘキシルアミノヘキシル)アミノカルボニル)フェニル]ヘキシルオキシ、[2-ブロモ-4-(N-ヘキシル-N-ジメチルアミノメチル)アミノカルボニルフェニル]メトキシ、(2-メトキシカルボニル-3-クロロフェニル)メトキシ基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子、炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基並びに置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基を有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を 1~2 個有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を 1~3 個有することがあり、且つアルコキシ部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基を例示できる。

[0210]

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基としては、例えば、ベンゾイルメトキシ、2-ベンゾイルエトキシ、1-ベンゾイルエトキシ、3-ベンゾイルプロポキシ、4-ベンゾイルブトキシ、5-ベンゾイルヘキシルオキシ、6-ベンゾイルヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-ベンゾイルエトキシ、2-メチル-3-

1-2 it possesses group which is chosen, phenyl alkoxy group where at same time alkoxy portion is straight or branched condition alkoxy group of carbon number 1~6 can be illustrated. 4-1-(4-bromophenyl) ethoxy, 3-(3-bromophenyl) propoxy, 4-(4-chlorophenyl) butoxy, 5-(2-iodo phenyl) pentyloxy, 6-(3-iodo phenyl) hexyloxy, (2 and 6-dichlorophenyl) methoxy, (2 and 3-dichlorophenyl) methoxy, (2 and 4-dichlorophenyl) methoxy, (3 and 4-difluoro phenyl) methoxy, (3, 4 and 5-trichlorophenyl) methoxy, (2-methoxycarbonyl phenyl) methoxy, (3-ethoxy carbonyl phenyl) methoxy, 2-(4-isopropoxy carbonyl phenyl) ethoxy, 3-(2-butoxy carbonyl phenyl) propoxy, 4-(3-pentyloxy carbonyl phenyl) butoxy, 5-(4-hexyloxy carbonyl phenyl) pentyloxy, 6-(2-methoxycarbonyl phenyl) hexyloxy, (2 and 4-dimethoxy carbonyl phenyl) methoxy, (2, 4 and 6-triethoxy carbonyl phenyl) methoxy, (2-carbamoyl phenyl) methoxy, 2-(3-methylamino carbonyl phenyl) ethoxy, 1-(4-ethylamino carbonyl phenyl) ethoxy, 3-(2-isopropyl amino carbonyl phenyl) propoxy, 4-(3-butyl amino carbonyl phenyl) butoxy, 5-(4-pentyl amino carbonyl phenyl) pentyloxy, 6-(2-hexyl amino carbonyl phenyl) hexyloxy, (2-dimethylamino carbonyl phenyl) methoxy, 2-(3-dibutyl amino carbonyl phenyl) ethoxy, 1-(4-di hexyl amino carbonyl phenyl) ethoxy, 3-{2-(N-ethyl-N-propyl amino carbonyl) phenyl} propoxy, (2-aminomethyl amino carbonyl phenyl) methoxy, 2-{3-(2-aminoethyl amino carbonyl) phenyl} ethoxy, 3-{4-(3-aminopropyl amino carbonyl) phenyl} propoxy, 4-{2-(4-amino butyl amino carbonyl) phenyl} butoxy, 5-{3-(5-amino pentyl amino carbonyl) phenyl} pentyloxy, 6-{4-(6-amino hexyl amino carbonyl) phenyl} hexyloxy, {2-(N-methyl-N-methylamino methyl) amino carbonyl phenyl} methoxy, 2-{3-(3-isopropyl aminopropyl amino carbonyl) phenyl} ethoxy, 3-

[0210]

On phenyl ring as benzoyl lower alkoxy group which has fact that it possesses the halogen atom as substituent, There are times when 1-3 it possesses halogen atom as substituent on the for example benzoyl methoxy, 2- benzoyl ethoxy, 1- benzoyl ethoxy, 3- benzoyl propoxy, 4- benzoyl butoxy, 5-benzoyl hexyloxy, 6-benzoyl hexyloxy, 1, 1- dimethyl -2- benzoyl ethoxy, 2- methyl -3- benzoyl propoxy, 2- (2

ベンゾイルプロポキシ、2-(2-クロロベンゾイル)エトキシ、1-(3-クロロベンゾイル)エトキシ、(4-クロロベンゾイル)メトキシ、3-(2-フルオロベンゾイル)プロポキシ、4-(3-フルオロベンゾイル)ブトキシ、5-(4-フルオロベンゾイル)ペンチルオキシ、6-(2-ブロモベンゾイル)ヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-(3-ブロモベンゾイル)エトキシ、2-メチル-3-(4-ブロモベンゾイル)プロポキシ、(2-ヨードベンゾイル)メトキシ、2-(3-ヨードベンゾイル)エトキシ、3-(4-ヨードベンゾイル)プロポキシ、4-(3,4-ジクロロベンゾイル)ブトキシ、5-(2,6-ジクロロベンゾイル)ペンチルオキシ、6-(2,3-ジクロロベンゾイル)ヘキシルオキシ、(2,4-ジクロロベンゾイル)メトキシ、(3,4-ジフルオロベンゾイル)メトキシ、(3,5-ジブロモベンゾイル)メトキシ、(3,4,5-トリクロロベンゾイル)メトキシ等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有することがあり、且つアルコキシ部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるベンゾイルアルコキシ基を例示できる。

【0211】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基としては、例えばスチリル、3-フェニル-2-プロペニル、3-フェニル-1-プロペニル、4-フェニル-3-ブテニル、4-フェニル-2-ブテニル、4-フェニル-1-ブテニル、5-フェニル-4-ペンテニル、5-フェニル-3-ペンテニル、5-フェニル-2-ペンテニル、5-フェニル-1-ペンテニル、1-メチル-3-フェニル-2-ブテニル、6-フェニル-5-ヘキセニル、1-メチルスチリル、2-,3-もしくは 4-クロロスチリル、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニル、3-(3-フルオロフェニル)-1-プロペニル、4-(4-ヨードフェニル)-3-ブテニル、5-(2-クロロフェニル)-4-ペンテニル、2-メチル-3-プロモスチリル、3,4-ジクロロスチリル、3,4,5-トリクロロスチリル等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有することのあるフェニル基を有する炭素数 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を例示できる。

【0212】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基としては、例えば、ベンゾイルメチル、2-ベンゾイルエチル、1-ベンゾイルエチル、3-ベンゾイルプロピル、4-ベンゾイルブチル、1,1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル、5-ベンゾイルペンチル、6-ベンゾイルヘキシル、2-メチル-3-ベンゾイルプロピル、(2-メチルベンゾイル)メチル、2-(2-メチルベンゾイル)エチル、1-(3-メチルベンゾイル)エチル、3-(4-メチルベンゾイル)プロピル、4-(2-エチルベンゾイル)ブチル、5-(3-プロピルベンゾイル)

-chlorobenzoyl) ethoxy, 1- (3 -chlorobenzoyl) ethoxy, (4 -chlorobenzoyl) methoxy, 3- (2 -fluoro benzoyl) propoxy, 4- (3 -fluoro benzoyl) butoxy, 5- (4 -fluoro benzoyl) pentyloxy, 6- (2 -bromo benzoyl) hexyloxy, 1, 1- dimethyl -2- (3 -bromo benzoyl) ethoxy, 2- methyl -3- (4 -bromo benzoyl) propoxy, (2 -iodo benzoyl) methoxy, 2- (3 -iodo benzoyl) ethoxy, 3- (4 -iodo benzoyl) propoxy, 4- (3 and 4 -dichloro benzoyl) butoxy, 5- (2 and 6 -dichloro benzoyl) pentyloxy, 6- (2 and 3 -dichloro benzoyl) hexyloxy, (2 and 4 -dichloro benzoyl) methoxy, (3 and 4 -difluoro benzoyl) methoxy, (3 and 5 -dibromo benzoyl) methoxy, (3, 4 and 5 -trichloro benzoyl) methoxy group or other phenyl ring, At same time benzoyl alkoxy group where alkoxy portion is straight or branched condition alkoxy group of carbon number 1~6 can be illustrated.

【0211】

On phenyl ring for example styryl, 3- phenyl -2- propenyl, 3- phenyl -1- propenyl, 4- phenyl -3- butenyl, 4- phenyl -2- butenyl, 4- phenyl -1- butenyl, 5-phenyl -4- pentenyl, 5-phenyl -3- pentenyl, 5-phenyl -2- pentenyl, 5-phenyl -1- pentenyl, 1- methyl -3- phenyl -2- butenyl, 6-phenyl -5-hexenyl, 1- methyl styryl, 2-, 3- or 4 -chloro styryl, 3- (4 -bromophenyl) - 2 -propenyl, 3- (3 -fluorophenyl) - 1 -propenyl, 4- (4 -iodo phenyl) - 3-butenyl, 5- (2 -chlorophenyl) - 4 -pentenyl, 2- methyl -3- bromo styryl, 3, 4- dichloro styryl, 3, 4, 5-trichloro styryl group or other phenyl ring straight or branched condition alkenyl group of carbon number 2~6 which possesses phenyl group which has times when 1 - 3 it possesses the halogen atom as substituent can be illustrated on as phenyl lower alkenyl group which has the fact that it possesses halogen atom as substituent .

【0212】

On phenyl ring as benzoyl lower alkyl group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent, for example benzoyl methyl, 2- benzoyl ethyl, 1- benzoyl ethyl, 3- benzoyl propyl, 4- benzoyl butyl, 1, 1- dimethyl -2- benzoyl ethyl, 5-benzoyl pentyl, 6-benzoyl hexyl, 2- methyl -3- benzoyl propyl, (2 -methyl benzoyl) methyl, 2- (2 -methyl benzoyl) ethyl, 1- (3 -methyl benzoyl) ethyl, 3- (4 -methyl benzoyl) propyl, 4- (2 -ethyl benzoyl) butyl, 5- (3 -propyl benzoyl) pentyl, 6- (4 -butyl benzoyl) hexyl, 2- (2 -pentyl benzoyl) ethyl, 1- (3 -hexyl benzoyl) ethyl, 3- (3 and 4 -dimethyl benzoyl) propyl, 2- (3, 4 and 5 -trimethyl

ペンチル、6-(4-ブチルベンゾイル)ヘキシル、2-(2-ペンチルベンゾイル)エチル、1-(3-ヘキシルベンゾイル)エチル、3-(3,4-ジメチルベンゾイル)プロピル、2-(3,4,5-トリメチルベンゾイル)エチル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~3 個有することのあるベンゾイルアルキル基を例示できる。

[0213]

ピロリジニル置換低級アルコキシ基としては、例えば、(2-ピロリジニル)メトキシ、2-(2-ピロリジニル)エトキシ、1-(3-ピロリジニル)エトキシ、3-(2-ピロリジニル)プロポキシ、4-(3-ピロリジニル)ブトキシ、5-(2-ピロリジニル)ペンチルオキシ、6-(3-ピロリジニル)ヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-(2-ピロリジニル)エトキシ、2-メチル-3-(3-ピロリジニル)プロポキシ、5-(1-ピロリジニル)ペンチルオキシ、2-(1-ピロリジニル)エトキシ基等のアルコキシ部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるピロリジニルアルコキシ基を例示できる。

[0214]

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1,1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチルベンジル、2-(2-メチルフェニル)エチル、1-(3-メチルフェニル)エチル、3-(4-メチルフェニル)プロピル、4-(2-エチルフェニル)ブチル、5-(3-プロピルフェニル)ペンチル、6-(4-ブチルフェニル)ヘキシル、2-(2-ペンチルフェニル)エチル、1-(3-ヘキシルフェニル)エチル、3-(3,4-ジメチルフェニル)プロピル、2-(3,4,5-トリメチルフェニル)エチル、(2-メチル-6-クロロフェニル)メチル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~3 個有することのあるフェニルアルキル基を例示できる。

[0215]

低級アルコキシカルボニル基としては、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を例示できる。

benzoyl) ethyl group or other alkyl portion with the straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6, At same time benzoyl alkyl group which has fact that 1 - 3 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as substituent can be illustrated on phenyl ring .

[0213]

As pyrrolidinyl substitution lower alkoxy group, pyrrolidinyl alkoxy group where for example (2 -pyrrolidinyl) methoxy, 2- (2 -pyrrolidinyl) ethoxy, 1- (3 -pyrrolidinyl) ethoxy, 3- (2 -pyrrolidinyl) propoxy, 4- (3 -pyrrolidinyl) butoxy, 5- (2 -pyrrolidinyl) pentyloxy, 6- (3 -pyrrolidinyl) hexyloxy, 1, 1- dimethyl -2- (2 -pyrrolidinyl) ethoxy, 2- methyl -3- (3 -pyrrolidinyl) propoxy, 5- (1 -pyrrolidinyl) pentyloxy, 2- (1 -pyrrolidinyl) ethoxy group or other alkoxy portion is straight or branched condition alkoxy group of carbon number 1~6 can be illustrated.

[0214]

On phenyl ring as phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent, for example benzyl, 2- phenylethyl, 1- phenylethyl, 3- phenyl propyl, 4- phenyl butyl, 1, 1- dimethyl -2- phenylethyl, 5-phenyl pentyl, 6-phenyl hexyl, 2- methyl -3- phenyl propyl, 2- methylbenzyl, 2- (2 -methylphenyl) ethyl, 1- (3 -methylphenyl) ethyl, 3- (4 -methylphenyl) propyl, 4- (2 -ethyl phenyl) butyl, 5- (3 -propyl phenyl) pentyl, 6- (4 -butyl phenyl) hexyl, 2- (2 -pentyl phenyl) ethyl, 1- (3 -hexyl phenyl) ethyl, 3- (3 and 4 -dimethylphenyl) propyl, 2- (3, 4 and 5 -trimethyl phenyl) ethyl, (2 -methyl -6-chlorophenyl) methyl group or other alkyl portion with the straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6, At same time phenyl alkyl group which has fact that 1 - 3 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as substituent can be illustrated on phenyl ring .

[0215]

As lower alkoxy carbonyl group, straight or branched condition alkoxy carbonyl group of for example methoxycarbonyl, ethoxy carbonyl, propoxy carbonyl, isopropoxy carbonyl, butoxy carbonyl, t- butoxy carbonyl, pentyloxy carbonyl, hexyloxy carbonyl group or other carbon number 1~6 can be illustrated.

アルコキシカルボニル基を例示できる。

【0216】

置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基としては、例えば、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、tert-ブチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル、ヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル、ジペンチルアミノカルボニル、ジヘキシルアミノカルボニル、N-メチル-N-エチルアミノカルボニル、N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル、N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル、N-メチル-N-ヘキシルアミノカルボニル、アミノメチルアミノカルボニル、2-アミノエチルアミノカルボニル、1-アミノエチルアミノカルボニル、3-アミノプロピルアミノカルボニル、4-アミノブチルアミノカルボニル、5-アミノペンチルアミノカルボニル、6-アミノヘキシルアミノカルボニル、1,1-ジメチル-2-アミノエチルアミノカルボニル、2-メチル-3-アミノプロピルアミノカルボニル、メチルアミノメチルアミノカルボニル、1-エチルアミノエチルアミノカルボニル、2-プロピルアミノエチルアミノカルボニル、3-イソプロピルアミノプロピルアミノカルボニル、4-ブチルアミノブチルアミノカルボニル、5-ペンチルアミノペンチルアミノカルボニル、6-ヘキシルアミノヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノメチルアミノカルボニル、2-ジエチルアミノエチルアミノカルボニル、2-ジメチルアミノエチルアミノカルボニル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチルアミノカルボニル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチルアミノカルボニル、N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル、N-エチル-N-(メチルアミノメチル)アミノカルボニル基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基を有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を 1~2 個有することのあるアミノカルボニル基を例示できる。

【0217】

置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基としては、例えば前記低級アルキル基に加えて、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2,3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、

【0216】

As substituent as amino carbonyl group which has fact that it possesses the group which is chosen from group which becomes amino substituted lower alkyl group which hastimes when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group and substituent, As for example amino carbonyl, methylamino carbonyl, ethylamino carbonyl, propyl amino carbonyl, isopropyl amino carbonyl, butyl amino carbonyl, t-butyl amino carbonyl, pentyl amino carbonyl, hexyl amino carbonyl, dimethylamino carbonyl, diethyl amino carbonyl, dipropyl amino carbonyl, dibutyl amino carbonyl, di pentyl amino carbonyl, di hexyl amino carbonyl, N-methyl -N-ethylamino carbonyl, N-ethyl -N-propyl amino carbonyl, N-methyl -N-butyl amino carbonyl, N-methyl -N-hexyl amino carbonyl, aminomethyl amino carbonyl, 2-aminoethyl amino carbonyl, 1-aminoethyl amino carbonyl, 3-aminopropyl amino carbonyl, 4-amino butyl amino carbonyl, 5-amino pentyl amino carbonyl, 6-amino hexyl amino carbonyl, 1, 1-dimethyl -2-aminoethyl amino carbonyl, 2-methyl -3-aminopropyl amino carbonyl, methylamino methylamino carbonyl, 1-ethylamino ethylamino carbonyl, 2-propyl aminoethyl amino carbonyl, 3-isopropyl aminopropyl amino carbonyl, 4-butyl amino butyl amino carbonyl, 5-pentyl amino pentyl amino carbonyl, 6-hexyl amino hexyl amino carbonyl, dimethylamino methylamino carbonyl, 2-diethyl aminoethyl amino carbonyl, 2-dimethylamino ethylamino carbonyl, (N-ethyl -N-propyl amino) methylamino carbonyl, 2-(N-methyl -N-hexyl amino) ethylamino carbonyl, N-methyl -N-(2-diethyl aminoethyl) amino carbonyl, N-ethyl -N-(methylamino methyl) amino carbonyl group or other substituent amino carbonyl group which hasfact that 1 - 2 it possesses group which is chosen can beillustrated from group which becomes straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 which possesses amino group which has times when 1 - 2 itpossesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as straight or branched condition alkyl group and substituent of carbon number 1~6.

【0217】

As substituent as lower alkyl group which has fact that, 1 - 3 it possesses hydroxymethyl, 2-hydroxyethyl, 1-hydroxyethyl, 3-hydroxypropyl, 2, 3-dihydroxypropyl, 4-hydroxybutyl, 1, 1-dimethyl -2-hydroxyethyl, 5, 5, 4-trihydroxy pentyl, 5-hydroxy pentyl, 6-hydroxy hexyl, 1-

1,1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5,5,4-トリヒドロキシペンチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、1-ヒドロキシイソプロピル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基等の水酸基を 1~3 個有することのある炭素数 1-6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0218】

カルバモイル基低級アルキル基としては、例えばカルバモイルメチル、2-カルバモイルエチル、1-カルバモイルエチル、3-カルバモイルプロピル、4-カルバモイルブチル、5-カルバモイルペンチル、6-カルバモイルヘキシル、1,1-ジメチル-2-カルバモイルエチル、2-メチル-3-カルバモイルプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルバモイルアルキル基を例示できる。

【0219】

アダマンチル基置換低級アルキル基としては、例えばアダマンチルメチル、2-アダマンチルエチル、1-アダマンチルエチル、3-アダマンチルプロピル、4-アダマンチルブチル、5-アダマンチルペンチル、6-アダマンチルヘキシル、1,1-ジメチル-2-アダマンチルエチル、2-メチル-3-アダマンチルプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアダマンチルアルキル基を例示できる。

【0220】

低級アルキルスルホニル基としては、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、tert-ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、ヘキシルスルホニル基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を挙げることができる。

【0221】

水酸基置換低級アルキル基としては、例えばヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2,3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、1,1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5,5,4-トリヒドロキシペンチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、1-ヒドロキシイソプロピル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基等の水酸基を 1~3 個有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0222】

フェニル低級アルキル基としては、例えばベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、1,1-ジメチル-2-フェニルエチル、2-メチル-3-フェニルプロピル基等のフェニル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

hydroxy isopropyl, 2- methyl -3- hydroxypropyl group or other hydroxy group, in addition to for example aforementioned lower alkyl group it possesses hydroxy group straight or branched condition alkyl group of carbon number 1- 6 which has factthat can be illustrated.

【0218】

As carbamoyl group lower alkyl group, carbamoyl alkyl group where for example carbamoyl methyl, 2- carbamoyl ethyl, 1- carbamoyl ethyl, 3- carbamoyl propyl, 4- carbamoyl butyl, 5-carbamoyl pentyl, 6-carbamoyl hexyl, 1, 1- dimethyl -2- carbamoyl ethyl, 2- methyl -3- carbamoyl propyl group or other alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 can be illustrated.

【0219】

As adamantyl group substituted lower alkyl group, adamantyl alkyl group where for example adamantyl methyl, 2- adamantyl ethyl, 1- adamantyl ethyl, 3- adamantyl propyl, 4- adamantyl butyl, 5-adamantyl pentyl, 6-adamantyl hexyl, 1, 1- dimethyl -2- adamantyl ethyl, 2- methyl -3- adamantyl propyl group or other alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 can be illustrated.

【0220】

As lower alkyl sulfonyl group, straight or branched condition alkyl sulfonyl group of for example methyl sulfonyl, ethyl sulfonyl, propyl sulfonyl, isopropyl sulfonyl, butyl sulfonyl, t- butyl sulfonyl, pentyl sulfonyl, hexyl sulfonyl group or other carbon number 1~6 can be listed.

【0221】

As hydroxyl group substitution lower alkyl group, straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 which 1 - 3possesses for example hydroxymethyl, 2- hydroxyethyl, 1- hydroxyethyl, 3- hydroxypropyl, 2, 3- dihydroxypropyl, 4- hydroxybutyl, 1, 1- dimethyl -2- hydroxyethyl, 5, 5, 4- trihydroxy pentyl, 5-hydroxy pentyl, 6-hydroxy hexyl, 1- hydroxy isopropyl, 2- methyl -3- hydroxypropyl group or other hydroxy group can be illustrated.

【0222】

As phenyl lower alkyl group, for example benzyl, 2- phenylethyl, 1- phenylethyl, 3- phenyl propyl, 4- phenyl butyl, 5-phenyl pentyl, 6-phenyl hexyl, 1, 1- dimethyl -2-

ンチル、6-フェニルヘキシル、1,1-ジメチル-2-フェニルエチル、2-メチル-3-フェニルプロピル、ジフェニルメチル、2,2-ジフェニルエチル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、フェニル基を 1~2 個有するアルキル基を挙げることができる。

【0223】

キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基としては、例えばキノリルカルボニル、2-フェニルキノリルカルボニル、3-フェニルキノリルカルボニル、4-フェニルキノリルカルボニル、5-フェニルキノリルカルボニル、6-フェニルキノリルカルボニル、7-フェニルキノリルカルボニル、8-フェニルキノリルカルボニル基等のキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基を例示できる。

【0224】

チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基としては、例えばチエニルカルボニル、2-フェニルチエニルカルボニル、3-フェニルチエニルカルボニル、4-フェニルチエニルカルボニル基等のチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基を例示できる。

【0225】

チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基としては、例えばチアゾリルカルボニル、2-フェニルチアゾリルカルボニル、4-フェニルチアゾリルカルボニル、5-フェニルチアゾリルカルボニル基等のチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基を例示できる。

【0226】

シクロアルキルカルボニル基としては、例えばシクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル基等の炭素数 3~8 のシクロアルキルカルボニル基を例示できる。

【0227】

置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基としては、例えば前記置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基に加えて、2-ヒドロキシアセチル、3-ヒドロキシブピオニル、2-ヒドロキシブピオニル、4-ヒドロ

phenylethyl, 2- methyl -3- phenyl propyl, diphenylmethyl, 2, 2- biphenyl ethyl group or other alkyl portion with straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6, can list alkyl group which 1 - 2 possesses phenyl group .

【0223】

On quinoline ring quinolyl carbonyl group which has fact that it possesses phenyl group as substituent can be illustrated on for example quinolyl carbonyl, 2- phenyl quinolyl carbonyl, 3- phenyl quinolyl carbonyl, 4- phenyl quinolyl carbonyl, 5-phenyl quinolyl carbonyl, 6-phenyl quinolyl carbonyl, 7-phenyl quinolyl carbonyl, 8-phenyl quinolyl carbonyl group or other quinoline ring as quinolyl carbonyl group which has fact that it possesses phenyl group as substituent .

【0224】

On thiophene ring thienyl carbonyl group which has fact that it possesses phenyl group as substituent can be illustrated on for example thienyl carbonyl, 2- phenyl thienyl carbonyl, 3- phenyl thienyl carbonyl, 4- phenyl thienyl carbonyl group or other thiophene ring as thienyl carbonyl group which has fact that it possesses phenyl group as substituent .

【0225】

On thiazole ring thiazolyl carbonyl group which has fact that it possesses phenyl group as substituent can be illustrated on for example thiazolyl carbonyl, 2- phenyl thiazolyl carbonyl, 4- phenyl thiazolyl carbonyl, 5-phenyl thiazolyl carbonyl group or other thiazole ring as thiazolyl carbonyl group which has fact that it possesses phenyl group as substituent .

【0226】

As cycloalkyl carbonyl group, cycloalkyl carbonyl group of for example cyclopropyl carbonyl, cyclobutyl carbonyl, cyclopentyl carbonyl, cyclohexyl carbonyl, cycloheptyl carbonyl, cyclooctyl carbonyl group or other carbon number 3~8 can be illustrated.

【0227】

In addition to lower alkanoyl group which has fact that it possesses the halogen atom as lower alkanoyl group which has fact that it possesses group which is chosen, as for example aforementioned substituent from group which becomes halogen atom and hydroxy group as substituent, straight or branched condition alkanoyl group of carbon

キシブチリル、5-ヒドロキシペンタノイル、6-ヒドロキシヘキサノイル、2,2-ジメチル-3-ヒドロキシプロピオニル等の置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を 1~3 個有していてもよい炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

【0228】

ハロゲン原子置換低級アルキル基としては、例えばトリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジブromoメチル、2-クロロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、3-ブromoプロピル、3-クロロプロピル、2,3-ジクロロプロピル、4,4,4-トリクロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2-メチルプロピル、5-ブromoヘキシル、5,6-ジクロロヘキシル基等の置換基としてハロゲン原子を 1~3 個有する炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0229】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジブromoピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0230】

置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基としては、例えば前記低級アルコキシカルボニル基に加えて、トリフルオロメトキシカルボニル、トリクロロメトキシカルボニル、クロロメトキシカルボニル、ブromoメトキシカルボニル、フルオロメトキシカルボニル、ヨードメトキシカルボニル、ジフルオロメトキシカルボニル、ジブromoメトキシカルボニル、2-クロロエトキシカルボニル、2,2,2-トリフルオロエトキシカルボニル、2,2,2-トリクロロエトキシカルボニル、3-ブromoプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、4,4,4-トリクロロブトキシカルボニル、4-フルオロブトキシカルボニル、5-クロロペンチルオキシカルボニル、3-クロロ-2-メチルプロポキシカルボニル、5-ブromoヘキシルオキシカルボニル、5,6-ジクロロヘキシルオキシカルボニル基等の置換基としてハロゲン原子を

number 1~6 which 1 - 3 is possible to have possessed group which is chosen can be illustrated from group which becomes halogen atom and hydroxy group as 2-hydroxy acetyl, 3-hydroxy propanoyl, 2-hydroxy propanoyl, 4-hydroxy butyryl, 5-hydroxy pentanoyl, 6-hydroxy hexanoyl, 2, 2-dimethyl -3- hydroxy propanoyl or other substituent .

【0228】

As halogen atom substituted lower alkyl group, straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 which 1 - 3 possesses halogen atom as for example trifluoromethyl, trichloromethyl, chloromethyl, bromomethyl, fluoromethyl, iodomethyl, difluoromethyl, dibromo methyl, 2-chloroethyl, 2, 2, 2- trifluoroethyl, 2, 2, 2- trichloroethyl, 3-bromo propyl, 3- chloropropyl, 2, 3- dichloropropyl, 4, 4, 4-trichloro butyl, 4- fluoro butyl, 5-chloro pentyl, 3- chloro -2- methylpropyl, 5-bromo hexyl, 5, 6-dichloro hexyl group or other substituent can be illustrated.

【0229】

As amino group which has fact that it possesses lower alkyl group as the substituent, 1 - 2 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as for example amino, methylamino, ethylamino, propyl amino, isopropyl amino, butyl amino, t- butyl amino, pentyl amino, hexyl amino, dimethylamino, diethyl amino, dipropyl amino, dibutyl amino, di pentyl amino, di hexyl amino, N-methyl -N- ethylamino, N- ethyl -N- propyl amino, N-methyl -N- butyl amino, N- methyl -N- hexyl amino group or other substituent amino group which has fact that can be illustrated.

【0230】

As lower alkoxy carbonyl group which has fact that it possesses halogen atom as the substituent, 1 - 3 it possesses halogen atom in addition to for example aforementioned lower alkoxy carbonyl group, as trifluoromethoxy carbonyl, trichloro methoxycarbonyl, chloro methoxycarbonyl, bromo methoxycarbonyl, fluoro methoxycarbonyl, iodo methoxycarbonyl, difluoro methoxycarbonyl, dibromo methoxycarbonyl, 2- chloro ethoxy carbonyl, 2, 2, 2-trifluoro ethoxy carbonyl, 2, 2, 2- trichloro ethoxy carbonyl, 3- bromo propoxy, 3- chloro propoxy, 2, 3- dichloro propoxy, 4, 4, 4- trichloro butoxy carbonyl, 4- fluoro butoxy carbonyl, 5-chloro pentyloxy carbonyl, 3- chloro -2- methyl propoxy carbonyl, 5-bromo hexyloxy carbonyl, 5, 6-dichloro hexyloxy carbonyl group or other substituent straight or branched condition alkoxy carbonyl group of the carbon number 1~6 which has also fact that can be illustrated.

1~3 個有することもある炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を例示できる。

【0231】

低級アルコキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば 2-メトキシアセチル、3-メトキシプロピオニル、2-エトキシアセチル、3-エトキシプロピオニル、4-エトキシブチリル、3-プロポキシプロピオニル、2-メトキシプロピオニル、6-プロポキシヘキサノイル、5-イソプロポキシペンタノイル、2,2-ジメチル-3-ブトキシプロピオニル、2-メチル-3-tert-ブトキシプロピオニル、2-ペンチルオキシアセチル、2-ヘキシルオキシアセチル基等のアルカノイル部分が炭素数 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基である炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコシアルカノイル基を挙げることができる。

【0232】

低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば 2-アセチルオキシアセチル、3-アセチルオキシプロピオニル、2-プロピオニルオキシアセチル、3-プロピオニルオキシプロピオニル、4-プロピオニルオキシブチリル、3-ブチリルオキシプロピオニル、2-アセチルオキシプロピオニル、6-プロピオニルオキシヘキサノイル、5-ブチリルオキシペンタノイル、2,2-ジメチル-3-ブチリルオキシプロピオニル、2-ペンタノイルオキシアセチル、2-ヘキサノイルオキシアセチル基等のアルカノイル部分が炭素数 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基である炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシアルカノイル基を挙げることができる。

【0233】

キノリルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば 2-キノリルオキシアセチル、3-キノリルオキシプロピオニル、2-キノリルオキシプロピオニル、4-キノリルオキシブチリル、2,2-ジメチル-3-キノリルオキシプロピオニル、5-キノリルオキシペンタノイル、6-キノリルオキシヘキサノイル基等のアルカノイル基部分の炭素数が 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるキノリルオキシアルカノイル基を例示できる。

【0234】

フェニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えばベンジルオキシカルボニル、2-フェニルエトキシカルボニル、1-フェニルエトキシカルボニル、3-フェニルプロポキシカルボニル、4-フェニルブトキシカルボニル、5-フェニルペンチルオキシカルボニル、6-フェニルヘキシルオキシカルボ

【0231】

As lower alkoxy-substituted lower alkanoyl group, straight or branched condition alkoxy alkanoyl group of carbon number 1~6 where for example 2- methoxy acetyl, 3- methoxy propanoyl, 2- ethoxy acetyl, 3- ethoxy propanoyl, 4- ethoxy butyryl, 3- propoxy propanoyl, 2- methoxy propanoyl, 6-propoxy hexanol, 5-isopropoxy pentanol, 2, 2- dimethyl -3- butoxy propanoyl, 2- methyl -3- t- butoxy propanoyl, 2- pentyloxy acetyl, 2- hexyloxy acetyl group or other alkanoyl portion is straight or branched condition alkanoyl group of carbon number 2~6 can be listed.

【0232】

As lower alkanoyl oxy substitution lower alkanoyl group, straight or branched condition alkanoyl oxy alkanoyl group of the carbon number 1~6 where for example 2- acetyl oxy acetyl, 3- acetyl oxy propanoyl, 2- propanoyl oxy acetyl, 3- propanoyl oxy propanoyl, 4- propanoyl oxy butyryl, 3- butyryl oxy propanoyl, 2- acetyl oxy propanoyl, 6-propanoyl oxy hexanoyl, 5-butyryl oxy pentanoyl, 2, 2- dimethyl -3- butyryl oxy propanoyl, 2- pentanoyl oxy acetyl, 2- hexanoyl oxy acetyl group or other alkanoyl portion is straight or branched condition alkanoyl group of carbon number 2~6 can belisted.

【0233】

As quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, quinolyloxy alkanoyl group where carbon number of the for example 2- quinolyloxy acetyl, 3- quinolyloxy propanoyl, 2- quinolyloxy propanoyl, 4- quinolyloxy butyryl, 2, 2- dimethyl -3- quinolyloxy propanoyl, 5-quinolyloxy pentanoyl, 6-quinolyloxy hexanoyl group or other alkanoyl group portion is straight or branched condition alkanoyl group 2 - 6 can be illustrated.

【0234】

As phenyl lower alkoxy carbonyl group, phenyl alkoxy carbonyl group where carbon number of for example benzyloxycarbonyl, 2- phenyl ethoxy carbonyl, 1- phenyl ethoxy carbonyl, 3- phenyl propoxy carbonyl, 4- phenyl butoxy carbonyl, 5-phenyl pentyloxy carbonyl, 6-phenyl hexyloxy carbonyl, 1, 1- dimethyl -2- phenyl ethoxy

ニル、1,1-ジメチル-2-フェニルエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェニルプロポキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフェニルアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

[0235]

ベンゾイル低級アルキル基としては、例えばベンゾイルメチル、2-ベンゾイルエチル、1-ベンゾイルエチル、3-ベンゾイルプロピル、4-ベンゾイルブチル、5-ベンゾイルペンチル、6-ベンゾイルヘキシル、1,1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル、2-メチル-3-ベンゾイルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾイルアルキル基を挙げることができる。

[0236]

キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-テトラヒドロキノリルオキシアセチル、3-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、2-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、4-テトラヒドロキノリルオキシブチリル、2,2-ジメチル-3-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、5-テトラヒドロキノリルオキシペンタノイル、6-テトラヒドロキノリルオキシヘキサノイル、2-(1-メチルテトラヒドロキノリルオキシ)アセチル、2-(2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ)アセチル、3-(2-エチルテトラヒドロキノリルオキシ)プロピオニル、2-(3-プロピルテトラヒドロキノリルオキシ)プロピオニル、4-(4-ブチルテトラヒドロキノリルオキシ)ブチリル、2,2-ジメチル-3-(5-ペンチルテトラヒドロキノリルオキシ)プロピオニル、5-(6-ヘキシルテトラヒドロキノリルオキシ)ペンタノイル、6-(7-メチルテトラヒドロキノリルオキシ)ヘキサノイル、2-(8-メチルテトラヒドロキノリルオキシ)アセチル、2-(1,4-ジメチルテトラヒドロキノリルオキシ)アセチル、2-(2,4,6-トリメチルテトラヒドロキノリルオキシ)アセチル、2-(1-メチル-2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ)アセチル、3-(2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ)プロピオニル、4-(2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ)ブチリル、5-(2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ)ペンタノイル、6-(2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ)ヘキサノイル、2-(1,6-ジメチル-2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ)アセチル基等のキノリン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ基が置換した炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖

carbonyl, 2- methyl -3- phenyl propoxy carbonyl group or other alkoxy carbonyl portion is straight or branched condition alkoxy carbonyl 1 - 6 can be listed.

[0235]

As benzoyl lower alkyl group, benzoyl alkyl group where for example benzoyl methyl, 2- benzoyl ethyl, 1- benzoyl ethyl, 3- benzoyl propyl, 4- benzoyl butyl, 5- benzoyl pentyl, 6- benzoyl hexyl, 1, 1- dimethyl -2- benzoyl ethyl, 2- methyl -3- benzoyl propyl group or other alkyl portion is straight chain and branched chain alkyl group of carbon number 1~6 can be listed.

[0236]

On quinoline ring as tetrahydro quinolyloxy substitution lower alkanoyl group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and oxo group as substituent, On for example 2- tetrahydro quinolyloxy acetyl, 3- tetrahydro quinolyloxy propanoyl, 2- tetrahydro quinolyloxy propanoyl, 4- tetrahydro quinolyloxy butyryl, 2, 2- dimethyl -3- tetrahydro quinolyloxy propanoyl, 5- tetrahydro quinolyloxy pentanoyl, 6- tetrahydro quinolyloxy hexanoyl, 2- (1 -methyl tetrahydro quinolyloxy) acetyl, 2- (2 -oxo tetrahydro quinolyloxy) acetyl, 3- (2 -ethyl tetrahydro quinolyloxy) propanoyl, 2- (3 -propyl tetrahydro quinolyloxy) propanoyl, 4- (4 -butyl tetrahydro quinolyloxy) butyryl, 2, 2- dimethyl -3- (5 -pentyl tetrahydro quinolyloxy) propanoyl, 5- (6 -hexyl tetrahydro quinolyloxy) pentanoyl, 6- (7 -methyl tetrahydro quinolyloxy) hexanoyl, 2- (8 -methyl tetrahydro quinolyloxy) acetyl, 2- (1 and 4 -dimethyl tetrahydro quinolyloxy) acetyl, 2- (2, 4 and 6 -trimethyl tetrahydro quinolyloxy) acetyl, 2- (1 -methyl -2- oxo tetrahydro quinolyloxy) acetyl, 3- (2 -oxo tetrahydro quinolyloxy) propanoyl, 4- (2 -oxo tetrahydro quinolyloxy) butyryl, 5- (2 -oxo tetrahydro quinolyloxy) pentanoyl, 6- (2 -oxo tetrahydro quinolyloxy) hexanoyl, 2- (1 and 6 -dimethyl -2- oxo tetrahydro quinolyloxy) acetyl group or other quinoline ring group which becomes straight or branched condition alkyl group and oxo group of carbon number 1~6 as substituent group which is chosen 1 - 3 straight or branched condition alkanoyl group of carbon number 2~6 which tetrahydro quinolyloxy group which has the fact that it possesses substitutes can be illustrated.

状アルカノイル基を例示できる。

【0237】

テトラヒドロナフチルオキシ低級アルカノイル基としては、例えば2-テトラヒドロナフチルオキシアセチル、3-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、2-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、4-テトラヒドロナフチルオキシブチリル、2,2-ジメチル-3-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、5-テトラヒドロナフチルオキシペンタノイル、6-テトラヒドロナフチルオキシヘキサノイル基等のアルカノイル部分の炭素数が 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるテトラヒドロナフチルオキシアルカノイル基を例示できる。

【0238】

フェニル低級アルケニルカルボニル基としては、例えばシンナモイル、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル、3-フェニル-1-プロペニルカルボニル、4-フェニル-3-ブテニルカルボニル、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル、4-フェニル-1-ブテニルカルボニル、5-フェニル-4-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-3-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-2-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-1-ペンテニルカルボニル、1-メチル-3-フェニル-2-ブテニルカルボニル、1-メチルシンナモイル基等のアルケニルカルボニル部分が炭素数 3~6 の直鎖又は分枝鎖状アルケニルカルボニル基であるフェニルアルケニルカルボニル基を例示できる。

【0239】

シクロアルケニル基としては、例えばシクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル基等の炭素数 3~8 のシクロアルケニル基を例示できる。

【0240】

フェニル低級アルキルアミノカルボニル基としては、例えばベンジリアミノカルボニル、(2-フェニルエチル)アミノカルボニル、(1-フェニルエチル)アミノカルボニル、(3-フェニルプロピル)アミノカルボニル、(4-フェニルブチル)アミノカルボニル、(5-フェニルペンチル)アミノカルボニル、(6-フェニルヘキシル)アミノカルボニル、(1,1-ジメチル-2-フェニルエチル)アミノカルボニル、(2-メチル-3-フェニルプロピル)アミノカルボニル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキルアミノカルボニル基を挙げることができる。

【0241】

【0237】

As tetrahydro naphthyloxy lower alkanoyl group, tetrahydro naphthyloxy alkanoyl group where carbon number of for example 2- tetrahydro naphthyloxy acetyl, 3- tetrahydro naphthyloxy propanoyl, 2- tetrahydro naphthyloxy propanoyl, 4- tetrahydro naphthyloxy butyryl, 2, 2- dimethyl -3- tetrahydro naphthyloxy propanoyl, 5-tetrahydro naphthyloxy pentanoyl, 6-tetrahydro naphthyloxy hexanoyl group or other alkanoyl portion is straight or branched condition alkanoyl group 2 - 6 can be illustrated.

【0238】

As phenyl lower alkenyl carbonyl group, phenyl alkenyl carbonyl group where for example cinnamoyl, 3- phenyl -2- propenyl carbonyl, 3- phenyl -1- propenyl carbonyl, 4- phenyl -3- butenyl carbonyl, 4- phenyl -2- butenyl carbonyl, 4- phenyl -1- butenyl carbonyl, 5-phenyl -4- pentenyl carbonyl, 5-phenyl -3- pentenyl carbonyl, 5-phenyl -2- pentenyl carbonyl, 5-phenyl -1- pentenyl carbonyl, 1- methyl -3- phenyl -2- butenyl carbonyl, 1- methyl cinnamoyl group or other alkenyl carbonyl portion is straight or branched condition alkenyl carbonyl group of carbon number 3~6 can be illustrated.

【0239】

As cycloalkenyl group, cycloalkenyl group of for example cyclopropenyl, cyclo butenyl, cyclopentenyl, cyclohexenyl, cyclo heptenyl, cyclo octenyl group or other carbon number 3~8 can be illustrated.

【0240】

As phenyl lower alkyl amino carbonyl group, phenyl alkyl amino carbonyl group where for example benzylamino carbonyl, (2 -phenylethyl) amino carbonyl, (1 -phenylethyl) amino carbonyl, (3 -phenyl propyl) amino carbonyl, (4 -phenyl butyl) amino carbonyl, (5 -phenyl pentyl) amino carbonyl, (6 -phenyl hexyl) amino carbonyl, (1 and 1 -dimethyl -2- phenylethyl) amino carbonyl, (2 -methyl -3- phenyl propyl) amino carbonyl group or other alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 can be listed.

【0241】

窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1-4 個有する飽和又は不飽和の 5 から 11 員環の単環又は二項環の複素環基としては、例えば、ピロリジニル、ペペリジニル、ペペラジニル、モルホリノ、チオモルホリノ、ピリジニル、ホモペペラジニル、1,2,5,6-テトラヒドロピリジニル、チエニル、キノリル、1,4-ジヒドロキノリル、ベンゾチアゾリル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピロリル、カルボステリル、3,4-ジヒドロカルボステリル、1,2,3,4-テトラヒドロキノリル、インドリル、イソインドリル、インドリニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾリジニル、イソキノリル、キナゾリジニル、1,2,3,4-テトラヒドロキノリル、1,2-ジヒドロイソキノリル、キノキサリニル、シンノリニル、フタラジニル、1,2,3,4-テトラゾリル、1,2,4-トリアゾリル、クロマニル、イソインドリニル、イソクロマニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピラゾリジニル、イミダゾ[1,2-a]ピリジニル、ベンゾフリル、2,3-ジヒドロベンゾ[b]フリル、ベンゾチエニル、1-アザシクロヘプチル、4H-クロメニル、1H-インダゾリル、イソインドリニル、2-イミダゾリニル、2-ピロリニル、フリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラニル、ピラゾリジニル、2-ピラゾリニル、キヌクリジニル、1,4-ベンゾオキサジニル、3,4-ジヒドロ-2H-1,4-ベンゾオキサジニル、3,4-ジヒドロ-2H-1,4-ベンゾチアジニル、1,4-ベンゾチアジニル、1,2,3,4-テトラヒドロキノキサリニル、1,3-ジチア-2,4-ジヒドロナフタレニル、テトラヒドロ-1,3-オキサジニル、テトラヒドロオキサゾリル、1,4-ジチアナフタレニル基等を例示できる。

[0242]

低級アルキル基、

フェニル基、

低級アルカノイル基、

ハロゲン原子、

フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を 1-3 個有する前記複素環としては、

例えば 1-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル、

2-オキソペペリジニル、

2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、

2-オキソピロリジニル、

5-フェニルチアゾリル、

1-メチルイミダゾリル、

for example pyrrolidinyl, bipyridinyl, piperazinyl, morpholino, thiomorpholino, pyridyl, homo piperazinyl, 1, 2, 5, 6-tetrahydro pyridyl, thienyl, quinolyl, 1, 4- dihydro quinolyl, benzo thiazolyl, pyrazyl, pyrimidyl, pyridazyl, pyrrolyl, carbostyryl, 3, 4- dihydro carbostyryl, 1, 2, 3, 4- tetrahydro quinolyl, indolyl, iso indolyl, indolinyl, benzoimidazolyl, benzo oxazolyl, imidazolidinyl, isoquinolyl, [kinazorijiniru], 1, 2, 3 and 4 -tetrahydro quinolyl, 1, 2- dihydro isoquinolyl, quinoxalinyl, cinnolyl, phthalazinyl, 1, 2, 3, 4- tetrazolyl, 1, 2, 4- triazolyl, chromanyl, isoindolinyl, iso chromanyl, pyrazolyl, imidazolyl, pyrazolidinyl, imidazo {1 and 2 -a } pyridyl, benzo furil, 2, 3- dihydro benzo [b] furil, benzo thienyl, 1- aza cycloheptyl, 4H-chromenyl, 1H-indazolyl, isoindolinyl, 2- imidazolyl, 2- pyrrolinyl, furil, oxazolyl, isooxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, pyranyl, pyrazolidinyl, 2- pyrazolinyl, quinuclidinyl, 1, 4- benzo oxazinyl, 3, 4- dihydro -2H-1, 4- benzo oxazinyl, 3, 4- dihydro -2H-1, 4- benzo thiazinyl, 1, 4- benzo thiazinyl, 1, 2, 3, 4- tetrahydro quinoxalinyl, 1, 3- di thia -2, 4- dihydro naphthalenyl, tetrahydro -1, 3- oxazinyl, tetrahydro oxazolyl, 1, 4- di thia naphthalenyl basis etc can be illustrated as monocycle of saturated or unsaturated 5 to 1 one member ring which 1 - 4 possesses the nitrogen atom, oxygen atom or sulfur atom or heterocyclic group of binary ring.

[0242]

lower alkyl group ,

phenyl group ,

lower alkanoyl group ,

halogen atom ,

As aforementioned heterocycle which 1 - 3 possesses group which is chosen from group which becomes phenyl lower alkyl group and oxo group ,

for example 1- oxo -1, 2, 3, 4- tetrahydroisoquinolyl ,

2 -oxo bipyridinyl ,

2 -oxo -1- aza cycloheptyl ,

2 -oxo pyrrolidinyl ,

5 -phenyl thiazolyl ,

1 -methyl imidazolyl ,

JP1997221476A

1997-8-26

1-プロピルイミダゾリル、	1 -propyl imidazolyl ,
4-メチルイミダゾリル、	4 -methyl imidazolyl ,
4-フェニルイミダゾリル、	4 -phenyl imidazolyl ,
1,4-ジメチルピロリル、	1 and 4 -dimethyl pyrrolyl ,
4-メチルピペラジニル、	4 -methyl piperazinyll ,
4-フェニルピペリジニル、	4 -phenyl bipyridinyl ,
4-メチルチアゾリル、	4 -methyl thiazolyl ,
2-オキソチアゾリル、	2 -oxo thiazolyl ,
5-エチルチアゾリル、	5 -ethyl thiazolyl ,
4-フェニルチアゾリル、	4 -phenyl thiazolyl ,
4-プロピルチアゾリル、	4 -propyl thiazolyl ,
5-ブチルチアゾリル、	5 -butyl thiazolyl ,
4-ペンチルチアゾリル、	4 -pentyl thiazolyl ,
2-ヘキシルチアゾリル、	2 -hexyl thiazolyl ,
4,5-ジメチルチアゾリル、	4 and 5 -dimethyl thiazolyl ,
5-フェニル-4-メチルチアゾリル、	5 -phenyl -4- methyl thiazolyl ,
1-エチルイミダゾリル、	1 -ethyl imidazolyl ,
4-プロピルイミダゾリル、	4 -propyl imidazolyl ,
5-ブチルイミダゾリル、	5 -butyl imidazolyl ,
1-ペンチルイミダゾリル、	1 -pentyl imidazolyl ,
1-ヘキシルイミダゾリル、	1 -hexyl imidazolyl ,
1,4-ジメチルイミダゾリル、	1 and 4 -dimethyl imidazolyl ,
1,4,5-トリメチルイミダゾリル、	1, 4 and 5 -trimethyl imidazolyl ,
1-フェニルイミダゾリル、	1 -phenyl imidazolyl ,
2-フェニルイミダゾリル、	2 -phenyl imidazolyl ,
5-フェニルイミダゾリル、	5 -phenyl imidazolyl ,
1-メチル-4-フェニルイミダゾリル、	1 -methyl -4- phenyl imidazolyl ,
3-メチル-1,2,4-トリアゾリル、	3 -methyl -1, 2, 4- triazolyl ,
5-エチル-1,2,4-トリアゾリル、	5 -ethyl -1, 2, 4- triazolyl ,
3-フェニル-1,2,4-トリアゾリル、	3 -phenyl -1, 2, 4- triazolyl ,
2-オキソ-1-メチルイミダゾリル、	2 -oxo -1- methyl imidazolyl ,
2-オキソイミダゾリル、	2 -oxo imidazolyl ,
2-エチルピロリル、	2 -ethyl pyrrolyl ,
3-プロピルピロリル、	3 -propyl pyrrolyl ,
5-ブチルピロリル、	5 -butyl pyrrolyl ,

4-ペンチルピロリル、	4 -pentyl pyrrolyl ,
2-ヘキシルピロリル、	2 -hexyl pyrrolyl ,
2,4,5-トリメチルピロリル、	2, 4 and 5 -trimethyl pyrrolyl ,
2-フェニルピロリル、	2 -phenyl pyrrolyl ,
2,5-ジフェニルピロリル、	2 and 5 -biphenyl pyrrolyl ,
2-メチル-5-フェニルピロリル、	2 -methyl -5-phenyl pyrrolyl ,
2-オキソピロリル、	2 -oxo pyrrolyl ,
1-メチル-1,2,3,4-テトラゾリル、	1 -methyl -1, 2, 3, 4- tetrazolyl ,
1-フェニル-1,2,3,4-テトラゾリル、	1 -phenyl -1, 2, 3, 4- tetrazolyl ,
1-エチル-1,2,3,4-テトラゾリル、	1 -ethyl -1, 2, 3, 4- tetrazolyl ,
1-プロピル-1,2,3,4-テトラゾリル、	1 -propyl -1, 2, 3, 4- tetrazolyl ,
1-ブチル-1,2,3,4-テトラゾリル、	1 -butyl -1, 2, 3, 4- tetrazolyl ,
1-ペンチル-1,2,3,4-テトラゾリル、	1 -pentyl -1, 2, 3, 4- tetrazolyl ,
1-ヘキシル-1,2,3,4-テトラゾリル、	1 -hexyl -1, 2, 3, 4- tetrazolyl ,
1-フェニル-1,2,3,4-テトラゾリル、	1 -phenyl -1, 2, 3, 4- tetrazolyl ,
2-メチルピリジル、	2 -methyl pyridyl ,
3-エチルピリジル、	3 -ethyl pyridyl ,
4-プロピルピリジル、	4 -propyl pyridyl ,
2-ブチルピリジル、	2 -butyl pyridyl ,
3-ペンチルピリジル、	3 -pentyl pyridyl ,
4-ヘキシルピリジル、	4 -hexyl pyridyl ,
2-フェニルピリジル、	2 -phenyl pyridyl ,
3-フェニルピリジル、	3 -phenyl pyridyl ,
4-フェニルピリジル、	4 -phenyl pyridyl ,
2,4-ジメチルピリジル、	2 and 4 -dimethyl pyridyl ,
2,4,6-トリメチルピリジル、	2, 4 and 6 -trimethyl pyridyl ,
2-メチル-4-フェニルピリジル、2,4-ジフェニルピリジル、2,4,6-トリフェニルピリジル、2-オキソピリジル、4-オキソピリジル、4-メチル-2-オキソピリジル、2-フェニル-4-オキソピリジル、3-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジル、4-エチルイミダゾ[1,2-a]ピリジル、3-フェニルイミダゾ[1,2-a]ピリジル、5-フェニルイミダゾ[1,2-a]ピリジル、3-メチル-1H-インダゾリル、3-フェニル-1H-インダゾリル、1-メチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル、5-エチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル、6-フェニル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル、1-オキソ-6-メチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル、1-オキソ-7-フェニル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル、3,4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピ	2 -methyl -4- phenyl pyridyl , 2, 4- biphenyl pyridyl , 2, 4, 6-triphenyl pyridyl , 2- oxo pyridyl , 4- oxo pyridyl , 4- methyl -2- oxo pyridyl , 2- phenyl -4- oxo pyridyl , 3- methyl imidazo aforementioned heterocyclic group which 1 - 3 possesses group which is chosen can be illustrated from group which becomes the phenyl alkyl group and oxo group where straight or branched condition alkanoyl group , halogen atom , alkyl portion of straight or branched condition alkyl group , phenyl group , carbon number 1~6 of {1 and 2 -a } pyridyl , 4- ethyl imidazo {1 and 2 -a } pyridyl , 3- phenyl imidazo {1 and 2 -a } pyridyl , 5-phenyl imidazo {1 and 2 -a } pyridyl , 3- methyl -1H-indazolyl , 3- phenyl -1H-indazolyl , 1- methyl -1, 2, 3, 4- tetrahydroisoquinolyl , 5-ethyl -1, 2, 3, 4- tetrahydroisoquinolyl , 6-phenyl -1, 2, 3, 4-

ルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、3,4,5-トリメチルピロリジニル、4-ブチルピロリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-ヘキシルペラジニル、4-ブチルピロリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-ヘキシルペラジニル、3-メチルチオモルホリノ、4-フェニルピロリジニル、3-フェニルピロリジニル、2-オキソ-4-メチルピロリジニル、2-オキソ-3-メチルピロリジニル、2-オキソ-4-フェニルピロリジニル、4-メチル-1-アザシクロヘプチル、5-フェニル-1-アザシクロヘプチル、6-メチル-2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、1-メチル-2-オキソイミダゾリジニル、1-イソブチル-2-オキソイミダゾリジニル、1-ベンジル-2-オキソイミダゾリジニル、2-オキソテトラヒドロ-1,3-オキサジニル、3-フェニル-2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、2-オキソテトラヒドロオキサゾリル、3-クロロピリジニル、4-メチルペラジニル、4-イソブチルペラジニル、4-メチルホモペラジニル、4-アセチルペラジニル、4-ベンジルペラジニル、4-エチルホモペラジニル基等の炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、フェニル基、炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基、ハロゲン原子、アルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキルであるフェニルアルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基を 1~3 個有する前記複素環基を例示できる。

【0243】

シアノ置換低級アルキル基としては、例えばシアノメチル、2-シアノエチル、1-シアノエチル、3-シアノプロピル、4-シアノブチル、5-シアノペンチル、6-シアノヘキシル、1,1-ジメチル-2-シアノエチル、2-メチル-3-シアノプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるシアノアルキル基を挙げることができる。

【0244】

テトラゾリル基置換低級アルキル基としては、例えばテトラゾリルメチル、2-テトラゾリルエチル、1-テトラゾリルエチル、3-テトラゾリルプロピル、4-テトラゾリルブチル、5-テトラゾリルペンチル、6-テトラゾリルヘキシル、1,1-ジメチル-2-テトラゾリルエチル、2-メチル-3-テトラゾリルプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるテトラゾリルアルキル基を例示できる。

【0245】

低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基としては、例えばアセチルオキシメチル、2-プロピオニルオキシエチル、1-ブチリルオキシエチル、3-アセチルオキシプロピル、4-アセチルオキ

tetrahydroisoquinolyl, 1-oxo-6-methyl-1, 2, 3, 4-tetrahydroisoquinolyl, 1-oxo-7-phenyl-1, 2, 3, 4-tetrahydroisoquinolyl, 3, 4-dimethyl piperazinyl, 3-ethyl pyrrolidinyl, 2-propyl pyrrolidinyl, 1-methyl pyrrolidinyl, 3, 4, 5-trimethyl bipyridinyl, 4-butyl bipyridinyl, 3-pentyl morpholino, 4-hexyl piperazinyl, 4-butyl bipyridinyl, 3-pentyl morpholino, 4-hexyl piperazinyl, 3-methylthio morpholino, 4-phenyl piperazinyl, 3-phenyl pyrrolidinyl, 2-oxo-4-methyl bipyridinyl, 2-oxo-3-methyl pyrrolidinyl, 2-oxo-4-phenyl bipyridinyl, 4-methyl-1-azacycloheptyl, 5-phenyl-1-azacycloheptyl, 6-methyl-2-oxo-1-azacycloheptyl, 1-methyl-2-oxoimidazolidinyl, 1-isobutyl-2-oxoimidazolidinyl, 1-benzyl-2-oxoimidazolidinyl, 2-oxo-tetrahydro-1, 3-oxazinyl, 3-phenyl-2-oxo-1-azacycloheptyl, 2-oxo-tetrahydro oxazolyl, 3-chloro pyridyl, 4-methyl piperazinyl, 4-isobutyl piperazinyl, 4-methyl homo piperazinyl, 4-acetyl piperazinyl, 4-benzyl piperazinyl, 4-ethyl homo piperazinyl group or other carbon number 1~6 is the straight or branched condition alkyl of carbon number 1~6.

【0243】

As cyano substituted lower alkyl group, cyanoalkyl group where for example cyanomethyl, 2-cyanoethyl, 1-cyanoethyl, 3-cyanopropyl, 4-cyano butyl, 5-cyano pentyl, 6-cyano hexyl, 1, 1-dimethyl-2-cyanoethyl, 2-methyl-3-cyanopropyl group or other alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 can be listed.

【0244】

As tetrazolyl group substituted lower alkyl group, tetrazolyl alkyl group where for example tetrazolyl methyl, 2-tetrazolyl ethyl, 1-tetrazolyl ethyl, 3-tetrazolyl propyl, 4-tetrazolyl butyl, 5-tetrazolyl pentyl, 6-tetrazolyl hexyl, 1, 1-dimethyl-2-tetrazolyl ethyl, 2-methyl-3-tetrazolyl propyl group or other alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 can be illustrated.

【0245】

As lower alkanoyl oxy group substituted lower alkyl group, straight or branched condition alkyl group of straight or branched condition alkanoyl oxy group substitute carbon Mathematical Formula 1~6 of for example acetyl oxy

シブチル、4-イソブチルオキシブチル、5-ペンタノイルオキシペンチル、6-アセチルオキシヘキシル、6-tert-ブチルカルボニルオキシヘキシル、1,1-ジメチル-2-ヘキサノイルオキシエチル、2-メチル-3-アセチルオキシプロピル基等の炭素数 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基置換炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0246】

置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基を例示できる。

【0247】

ピリジル低級アルキル基としては、例えば(4-ピリジル)メチル、1-(3-ピリジル)エチル、2-(2-ピリジル)エチル、3-(2-ピリジル)プロピル、4-(3-ピリジル)ブチル、5-(4-ピリジル)ペンチル、6-(2-ピリジル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(3-ピリジル)エチル、2-メチル-3-(4-ピリジル)プロピル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基を挙げることができる。

【0248】

フェノキシ低級アルコキシカルボニル基としては、例えばフェノキシメトキシカルボニル、2-フェノキシエトキシカルボニル、1-フェノキシエトキシカルボニル、3-フェノキシプロポキシカルボニル、4-フェノキシブトキシカルボニル、5-フェノキシペンチルオキシカルボニル、6-フェノキシヘキシルオキシカルボニル、1,1-ジメチル-2-フェノキシエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェノキシプロポキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフェノキシアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0249】

ピリジル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば(4-ピリジル)メトキシカルボニル、(2-ピリジル)メトキシカルボニル、(3-ピリジル)メトキシカルボニル、2-(2-ピリジル)エトキシカルボニル、1-(1-ピリジル)エトキシカルボニル、3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル、4-(4-ピリジル)ブトキシカルボニル、5-(3-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル、6-(2-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル、

methyl, 2- propanoyl oxyethyl, 1- butyryl oxyethyl, 3- acetyl oxypropyl, 4- acetyl oxy butyl, 4- isobutyryl oxy butyl, 5- pentanoyl oxy pentyl, 6- acetyl oxy hexyl, 6- t- butyl carbonyl oxy hexyl, 1, 1- dimethyl -2- hexanoyl oxyethyl, 2- methyl -3- acetyl oxypropyl group or other carbon number 2~6 can be illustrated.

【0246】

As amino group which has fact that it possesses lower alkanoyl group as the substituent, it possesses straight or branched condition alkanoyl group of carbon number 1~6 as the for example amino, formyl amino, acetyl amino, propanoyl amino, butyryl amino, isobutyryl amino, pentanoyl amino, t- butyl carbonyl amino, hexanoyl amino group or other substituent amino group which has fact that can be illustrated.

【0247】

As pyridyl lower alkyl group, pyridyl alkyl group where for example (4 -pyridyl) methyl, 1- (3 -pyridyl) ethyl, 2- (2 -pyridyl) ethyl, 3- (2 -pyridyl) propyl, 4- (3 -pyridyl) butyl, 5- (4 -pyridyl) pentyl, 6- (2 -pyridyl) hexyl, 1, 1- dimethyl -2- (3 -pyridyl) ethyl, 2- methyl -3- (4 -pyridyl) propyl group or other alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 can be listed.

【0248】

As phenoxy lower alkoxy carbonyl group, phenoxy alkoxy carbonyl group where carbon number of for example phenoxy methoxycarbonyl, 2- phenoxy ethoxy carbonyl, 1- phenoxy ethoxy carbonyl, 3- phenoxy propoxy carbonyl, 4- phenoxy butoxy carbonyl, 5- phenoxy pentyloxy carbonyl, 6- phenoxy hexyloxy carbonyl, 1, 1- dimethyl -2- phenoxy ethoxy carbonyl, 2- methyl -3- phenoxy propoxy carbonyl group or other alkoxy carbonyl portion is straight or branched condition alkoxy carbonyl 1 - 6 can be listed.

【0249】

As pyridyl lower alkoxy carbonyl group, pyridyl alkoxy carbonyl group where carbon number of for example (4 -pyridyl) methoxycarbonyl, (2 -pyridyl) methoxycarbonyl, (3 -pyridyl) methoxycarbonyl, 2- (2 -pyridyl) ethoxy carbonyl, 1- (1 -pyridyl) ethoxy carbonyl, 3- (3 -pyridyl) propoxy carbonyl, 4- (4 -pyridyl) butoxy carbonyl, 5- (3 -pyridyl) pentyloxy carbonyl, 6- (2 -pyridyl) hexyloxy carbonyl, 1, 1- dimethyl -2- (4 -pyridyl) ethoxy carbonyl, 2-

ル、1,1-ジメチル-2-(4-ピリジル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル、基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるピリジアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0250】

フルオレニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば(5-フルオレニル)メトキシカルボニル、2-(2-フルオレニル)エトキシカルボニル、1-(1-フルオレニル)エトキシカルボニル、3-(3-フルオレニル)プロポキシカルボニル、4-(4-フルオレニル)ブトキシカルボニル、5-(5-フルオレニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(1-フルオレニル)ヘキシルオキシカルボニル、1,1-ジメチル-2-(2-フルオレニル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(3-フルオレニル)プロポキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフルオレニルアルコキシカルボニル基を例示できる。

【0251】

低級アルケニルオキシカルボニル基としては、例えばビニルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル、2-ブテニルオキシカルボニル、3-ブテニルオキシカルボニル、1-メチルアリルオキシカルボニル、2-ペンテニルオキシカルボニル、2-ヘキセニルオキシカルボニル基等の炭素数 2~6 の直鎖又は分枝鎖状アルケニルオキシカルボニル基を例示できる。

【0252】

ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、

低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基としては、

例えば(4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、
2-(3-ピペリジニル)エトキシカルボニル、
1-(2-ピペリジニル)エトキシカルボニル、
3-(1-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、
4-(4-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、
5-(3-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、
6-(2-ピペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、
1,1-ジメチル-2-(4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(1-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、(1-エチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、

methyl -3- (3 -pyridyl) propoxy carbonyl , basic or other alkoxy carbonyl portion is straight or branched condition alkoxy carbonyl 1 - 6 can belisted.

【0250】

As fluorenyl lower alkoxy carbonyl group , fluorenyl alkoxy carbonyl group where carbon number of for example (5 -fluorenyl) methoxycarbonyl , 2- (2 -fluorenyl) ethoxy carbonyl , 1- (1 -fluorenyl) ethoxy carbonyl , 3- (3 -fluorenyl) propoxy carbonyl , 4- (4 -fluorenyl) butoxy carbonyl , 5- (5 -fluorenyl) pentyloxy carbonyl , 6- (1 -fluorenyl) hexyloxy carbonyl , 1, 1- dimethyl -2- (2 -fluorenyl) ethoxy carbonyl , 2- methyl -3- (3 -fluorenyl) propoxy carbonyl group or other alkoxy carbonyl portion is straight or branched condition alkoxy carbonyl 1 - 6 can be illustrated.

【0251】

As lower alkenyl oxycarbonyl group , straight or branched condition alkenyl oxycarbonyl group of for example vinyl oxycarbonyl , allyl oxycarbonyl , 2- butenyl oxycarbonyl , 3- butenyl oxycarbonyl , 1- methyl allyl oxycarbonyl , 2- pentenyl oxycarbonyl , 2- hexenyl oxycarbonyl group or other carbon number 2~6 can be illustrated.

【0252】

On piperidine ring as substituent lower alkanoyl group ,

As bipyridinyl lower alkoxy carbonyl group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkoxy carbonyl group and lower alkyl group ,

for example (4 -bipyridinyl) methoxycarbonyl ,

2 - (3 -bipyridinyl) ethoxy carbonyl ,

1 - (2 -bipyridinyl) ethoxy carbonyl ,

3 - (1 -bipyridinyl) propoxy carbonyl ,

4 - (4 -bipyridinyl) butoxy carbonyl ,

5 - (3 -bipyridinyl) pentyloxy carbonyl ,

TRANSLATION STALLED On methoxycarbonyl group or other piperidine ring bipyridinyl alkoxy carbonyl group where carbon number of alkoxy carbonyl portion which has the times when 1 - 3 it possesses group which is chosen is straight or

ルボニル、(1-*t*-ブトキシカルボニル-4-*p*-ペリジニル)メトキシカルボニル、(1-アセチル-4-*p*-ペリジニル)メトキシカルボニル、2-(1-メチル-4-*p*-ペリジニル)エトキシカルボニル、1-(4-プロピル-1-*p*-ペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-ブチル-3-*p*-ペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(3-ペンチル-2-*p*-ペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキシル-4-*p*-ペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、(1,2-ジメチル-4-*p*-ペリジニル)メトキシカルボニル、(3,4,5-トリメチル-1-*p*-ペリジニル)メトキシカルボニル、2-(1-メトキシカルボニル-4-*p*-ペリジニル)エトキシカルボニル、1-(1-エトキシカルボニル-4-*p*-ペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-プロポキシカルボニル-1-*p*-ペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(3-ペンチルオキシカルボニル-2-*p*-ペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキシルオキシカルボニル-4-*p*-ペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(4-メトキシカルボニル-1-*p*-ペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、2-(2-アセチル-1-*p*-ペリジニル)エトキシカルボニル、1-(3-プロピオニル-2-*p*-ペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-ブチル-3-*p*-ペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(4-ペンタノイル-1-*p*-ペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキサノイル-4-*p*-ペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(1-アセチル-2-メチル-4-*p*-ペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、(1-エトキシカルボニル-2,6-ジメチル-4-*p*-ペリジニル)メトキシカルボニル基等の*p*-ペリジン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイル基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるアルコキシカルボニル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルである*p*-ペリジニルアルコキシカルボニル基を例示できる。

[0253]

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基としては、例えばアミノスルホニルオキシ、メチルアミノスルホニルオキシ、エチルアミノスルホニルオキシ、プロピルアミノスルホニルオキシ、イソプロピルアミノスルホニルオキシ、ブチルアミノスルホニルオキシ、*tert*-ブチルアミノスルホニルオキシ、ペンチルアミノスルホニルオキシ、ヘキシルアミノスルホニルオキシ、ジメチルアミノスルホニルオキシ、ジエチルアミノスルホニルオキシ、ジプロピルアミノスルホニルオキシ、ジブチルアミノスルホニルオキシ、ジペンチルアミノスルホニルオキシ、ジヘキシルアミノスルホニルオキシ、*N*-メチル-*N*-エチルアミノスルホニルオキシ、*N*-エチル-

branched condition alkoxy carbonyl 1 - 6 can be illustrated from group which becomes straight or branched condition alkoxy carbonyl group of alkanoyl group, carbon number 1~6 of straight or branched condition of carbon number 1~6 and straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as substituent. hexyloxy carbonyl, 1, 1- dimethyl -2-ethoxy carbonyl, 2- methyl -3- propoxy carbonyl, methoxycarbonyl, methoxycarbonyl, methoxycarbonyl, 2-ethoxy carbonyl, 1- ethoxy carbonyl, 3- propoxy carbonyl, 4- butoxy carbonyl, 5- pentyloxy carbonyl, methoxycarbonyl, 2- ethoxy carbonyl, 1- ethoxy carbonyl, 3- propoxy carbonyl, 4- butoxy carbonyl, 5- pentyloxy carbonyl, 6- hexyloxy carbonyl, 2- ethoxy carbonyl, 1- ethoxy carbonyl, 3- propoxy carbonyl, 4- butoxy carbonyl, 5- pentyloxy carbonyl, 6- hexyloxy carbonyl, 4 -butyl -3- bipyridinyl 2 -bipyridinyl 1 -*t*-butoxycarbonyl -4- bipyridinyl 4 -bipyridinyl 1 -bipyridinyl 1 -ethyl -4- bipyridinyl 1 -hexyl -4- bipyridinyl 1 -acetyl -4- bipyridinyl 4 -propyl -1- bipyridinyl 3 -pentyl -2- bipyridinyl 1 -methyl -4- bipyridinyl 3, 4 and 5 -trimethyl -1- bipyridinyl 1 and 2 -dimethyl -4- bipyridinyl hiperjiniro 4 -propoxy carbonyl -1- bipyridinyl 1 -ethoxy carbonyl -4- bipyridinyl 1 -methoxycarbonyl -4- * 3 -pentyloxy carbonyl -2- bipyridinyl 4 -methoxycarbonyl -1- bipyridinyl 1 -hexyloxy carbonyl -4- bipyridinyl 2 -acetyl -1- bipyridinyl 3 -propanoyl -2- bipyridinyl 4 -pentanoyl -1- bipyridinyl 4 -butyryl -3- bipyridinyl 1 -hexanoyl -4- bipyridinyl 1 -ethoxy carbonyl -2, 6-dimethyl -4- bipyridinyl 1 -acetyl -2- methyl -4- bipyridinyl

[0253]

As amino sulfonyloxy group which has fact that it possesses lower alkyl group as the substituent, 1 - 2 it possesses straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 as for example amino sulfonyloxy, methylamino sulfonyloxy, ethylamino sulfonyloxy, propyl amino sulfonyloxy, isopropyl amino sulfonyloxy, butyl amino sulfonyloxy, *t*-butyl amino sulfonyloxy, pentyl amino sulfonyloxy, hexyl amino sulfonyloxy, dimethylamino sulfonyloxy, diethyl amino sulfonyloxy, dipropyl amino sulfonyloxy, dibutyl amino sulfonyloxy, di pentyl amino sulfonyloxy, di hexyl amino sulfonyloxy, *N*- methyl -*N*- ethylamino sulfonyloxy, *N*- ethyl -*N*- propyl amino sulfonyloxy, *N*- methyl -*N*- butyl amino sulfonyloxy, *N*- methyl -*N*- hexyl amino sulfonyloxy group or other substituent amino sulfonyloxy group which has

N-プロピルアミノスルホニルオキシ、N-メチル-N-ブチルアミノスルホニルオキシ、N-メチル-N-ヘキシルアミノスルホニルオキシ基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノスルホニルオキシ基を例示できる。

【0254】

フェニル低級アルキル基としては、例えばベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1,1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

【0255】

低級アルカノイル基置換アミノ基としては、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ基等の置換基として炭素数 1~6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基置換アミノ基を例示できる。

【0256】

本発明の化合物は、種々の方法により製造することができる。

【0257】

【化 28】

fact that can be illustrated.

【0254】

As phenyl lower alkyl group , phenyl alkyl group where for example benzyl , 2- phenylethyl , 1- phenylethyl , 3- phenyl propyl , 4- phenyl butyl , 1, 1- dimethyl -2- phenylethyl , 5-phenyl pentyl , 6-phenyl hexyl , 2- methyl -3- phenylpropyl group or other alkyl portion is straight or branched condition alkyl group of carbon number 1~6 can be illustrated.

【0255】

As lower alkanoyl group substituted amino group , straight or branched condition alkanoyl group substituted amino group of carbon number 1~6 can be illustrated as formyl amino , acetylamino , propanoyl amino , butyryl amino , isobutyryl amino , pentanoyl amino , t- butyl carbonyl amino , hexanoyl amino group or other substituent .

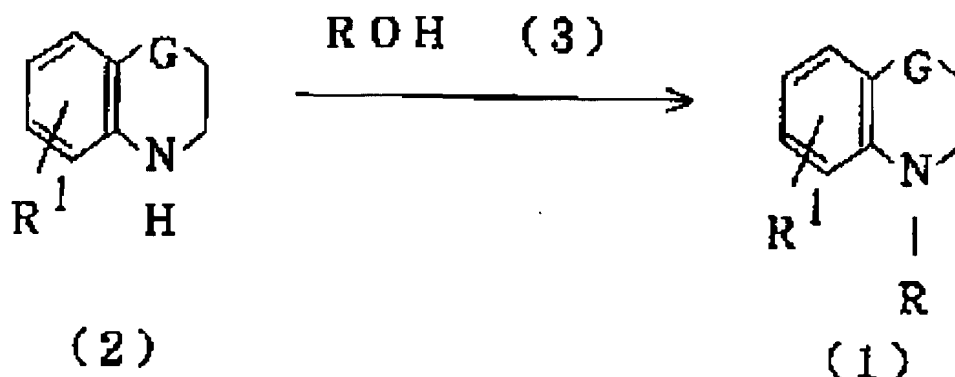
【0256】

It can produce compound of this invention , with various methods .

【0257】

[Chemical Formula 28]

反応式 - 1



【0258】

〔式中、G、R¹、R²、R³、R 及び X は前記に同じ。〕

反応式-1 で示される方法は、一般式(2)のベンゾヘテロ環化合物と一般式(3)のカルボン酸とを、通常のアミド結合生成反応にて反応させる方法である。

酸アミド結合生成反応には公知のアミド結合生成反応の条件を容易に適用できる。

例えば(イ)混合酸無水物法、即ちカルボン酸(3)にアルキルハロ炭酸エステルを反応させて混合酸無水物とし、これにアミン(2)を反応させる方法、(ロ)活性エステル法、即ちカルボン酸(3)を p-ニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステルとし、これにアミン(2)を反応させる方法、(ハ)カルボジイミド法、即ちカルボン酸(3)にアミン(2)をジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存在下に縮合反応させる方法、(ニ)その他の方法、例えばカルボン酸(3)を無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン(2)を反応させる方法、カルボン酸(3)と低級アルコールとのエステルにアミン(2)を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸(3)の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法等を挙げることができる。

[0258]

{In Formula, as for G, R¹, R², R³, R and X same to description above. }

method which is shown with reaction scheme -1 benzo heterocyclic compound of General Formula (2) and carboxylic acid of general formula (3), is method which reacts with conventional amide bond production reaction .

condition of amide bond production reaction of public knowledge can be applied to acid amide bond production reaction easily.

Method reacting, of designating alkyl halo- carbonate ester as mixed acid anhydride in the for example (J2) mixed acid anhydride method , , namely carboxylic acid (3) amine (2) reacting to this. Method of designating (jp2) active ester method , namely carboxylic acid (3) as the p- nitrophenyl ester , N- hydroxy succinimide ester , 1- hydroxybenzotriazole ester or other active ester , amine (2) reacting to this. In (jp3) carbodiimide method, namely carboxylic acid (3) amine (2) under existing of dicyclohexyl carbodiimide , carbonyl diimidazole or other activator condensation reaction method of doing. (jp4) other methods. Method of designating for example carboxylic acid (3) as carboxylic acid anhydride with acetic anhydride or other drying agent , amine (2) reacting to this. carboxylic acid (3) with in ester of lower alcohol amine (2) method of reacting under high pressure high temperature . method etc which amine (2) reacts to acid halide , namely carboxylic acid halide of carboxylic acid (3) can be listed.

[0259]

上記混合酸無水物法(イ)において用いられる混合酸無水物は、通常のショッテン-バウマン反応と同様の反応により得られ、これを通常単離することなくアミン(2)と反応させることにより一般式(1)の本発明化合物が製造される。

上記ショッテン-バウマン反応は塩基性化合物の存在下に行なわれる。

用いられる塩基性化合物としては、ショッテン-バウマン反応に慣用の化合物例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1-メチル-2-ピロリジノン(NMP)、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基等が挙げられる。

該反応は、通常-20~100 deg C 程度、好ましくは0~50 deg C 程度において行なわれ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~2時間程度である。

得られた混合酸無水物とアミン(2)との反応は通常-20~150 deg C 程度、好ましくは10~50 deg C 程度において行なわれ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~5時間程度である。

混合酸無水物法は一般に溶媒中に行なわれる。

用いられる溶媒としては混合酸無水物法に慣用の溶媒がいずれも使用可能であり、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、p-クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒等又は之等の混合溶媒等が挙げられる。

混合酸無水物法において使用されるアルキルハロ炭酸エステルとしては例えばクロロ蟻酸メチル、ブromo蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、ブromo蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。

該法におけるカルボン酸(3)、アルキルハロ炭酸エステル及びアミン(2)の使用割合は、通常等モ

[0259]

mixed acid anhydride which is used in above-mentioned mixed acid anhydride method (J2) is acquired by reaction which is similar to conventional Schotten-Baumann reaction, without usually isolating this the compound of this invention of General Formula (1) is produced amine (2) with by reacting.

Above-mentioned Schotten-Baumann reaction is done under existing of basic compound.

Usual compound example you obtain in Schotten-Baumann reaction as basic compound which is used, triethylamine, trimethyl amine, pyridine, dimethyl aniline, 1- methyl -2- pyrrolidinon (NMP), N- methylmorpholine, 1, 5-diazabicyclo {4.3 . 0} nonene -5 (DBN), 1 and 8 -diazabicyclo {5.4 . 0} undecene -7 (DBU), 1 and 4 -diazabicyclo can list {2.2 . 2} octane (DABCO) or other organic base, potassium carbonate, sodium carbonate, potassium hydrogen carbonate, sodium hydrogen carbonate or other inorganic base etc.

said reaction is done usually - in 20 - 100 deg C extent and preferably 0~50deg C extent, reaction time is 5 min ~10 hours extent and preferably 5 min ~2 hours extent.

mixed acid anhydride and amine which it acquires (2) with reaction is done usually - in 20 - 150 deg C extent and preferably 10~50deg C extent, reaction time is 5 min ~10 hours extent and preferably 5 min ~5 hours extent.

mixed acid anhydride method is done generally in solvent.

In each case with usable, concretely chloroform, dichloromethane, dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, benzene, p- chlorobenzene, toluene, xylene or other aromatic hydrocarbons, diethyl ether, diisopropyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, methyl acetate, ethylacetate or other esters, N, N- dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, acetonitrile, hexamethyl phosphoric acid triamide or other aprotic polar solvent etc or Itaru or other mixed solvent etc can list to mixed acid anhydride method usual solvent as solvent which is used.

You can list for example methyl chloroformate, bromo methyl formate, ethyl chloroformate, bromo ethyl formate, chloroformic acid isobutyl etc as alkyl halo- carbonate ester which is used in mixed acid anhydride method.

carboxylic acid in said method (3), as for portion used of alkyl halo- carbonate ester and the amine (2), usually making each

ルずつとするのがよいが、アミン(2)に対してアルキルハロ炭酸エステル及びカルボン酸(3)はそれぞれ 1~1.5 倍モル量程度の範囲内で使用することができる。

【0260】

また前記その他の方法(二)の内、カルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中で行なわれる。

用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば上記シュotten-バウマン反応に用いられる塩基性化合物の他に、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を例示できる。

また用いられる溶媒としては、例えば上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、ピリジン、アセトン、水等を例示できる。

アミン(2)とカルボン酸ハライドとの使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択でき、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~5 倍モル量程度用いるのがよい。

該反応は通常-20~180 deg C 程度、好ましくは 0~150 deg C 程度にて行なわれ、一般に 5 分~30 時間程度で反応は完結する。

【0261】

更に上記反応式-1 に示すアミド結合生成反応は、カルボン酸(3)とアミン(2)とを、フェニルホスフィン-2,2'-ジチオジピリジン、ジフェニルホスフィンクロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリデート、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド等のリン化合物の縮合剤の存在下に反応させる方法によっても実施できる。

【0262】

該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物の存在下に、通常-20~150 deg C 程度、好ましくは 0~100 deg C 程度付近にて行なわれ、一般に 5 分~30 時間程度にて反応は終了する。

縮合剤及びカルボン酸(3)の使用量はアミン(2)

equimole it is good you can use the alkyl halo- carbonate ester and carboxylic acid (3) respectively inside range of 1 - 1.5 times molar amount extent, but vis-a-vis amine (2).

【0260】

In addition among aforementioned other method (jp4), in carboxylic acid halide when method which reacts is adopted, said reaction under existing of basic compound , is done amine (2) in suitable solvent .

Widely be able to use those of public knowledge , for example sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride , potassium hydride etc can be illustrated to other than basic compound which is used for for example above-mentioned Schotten-Baumann reaction , as basic compound which is used.

In addition methanol , ethanol , propanol , butanol , 3-methoxy -1- butanol , ethyl cellosolve , methyl cellosolve or other alcohols , pyridine , acetone , water etc can be illustrated to other than the solvent which is used for for example above-mentioned mixed acid anhydride method as solvent which is used.

amine (2) with as portion used of carboxylic acid halide , there not to be especially limitation and be able to select appropriately inside widerange, it is good equimolar amount extent and preferably equimole ~5 times molar amount extent to use the latter atleast, usually vis-a-vis former .

said reaction at usually - is done 20 - 180 deg C extent and preferably 0~150deg C extent, reaction completes generally at 5 min ~30 time extent.

【0261】

Furthermore amide bond production reaction which is shown in above-mentioned reaction scheme -1 the carboxylic acid (3) with can execute amine (2), even with method which reacts under existing of condensing agent of phenyl phosphine -2, 2*-dithio di pyridine , diphenyl phosphinyl chloride , phenyl -N- phenyl phosphoramidate chloridate , diethyl chloro phosphate , diethyl cyanophosphate , biphenyl phosphoric acid azido , bis (2 -oxo -3- oxazol danyl) phosphinic chloride or other phosphorus compound .

【0262】

As for said reaction, under existing of solvent and basic compound which are used with method which amine (2) reacts to the above-mentioned carboxylic acid halide , usually - 20 - 150 deg C extent, it is done with preferably 0~100deg C extent vicinity , reaction ends generally at 5 min ~30 time extent.

amount used of condensing agent and carboxylic acid (3)

JP1997221476A

1997-8-26

に対して夫々少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~2 倍モル量程度使用するのがよい。

respectively at least equimolar amount extent and preferably equimole ~2-fold molar amount extent using is good vis-a-vis amine (2).

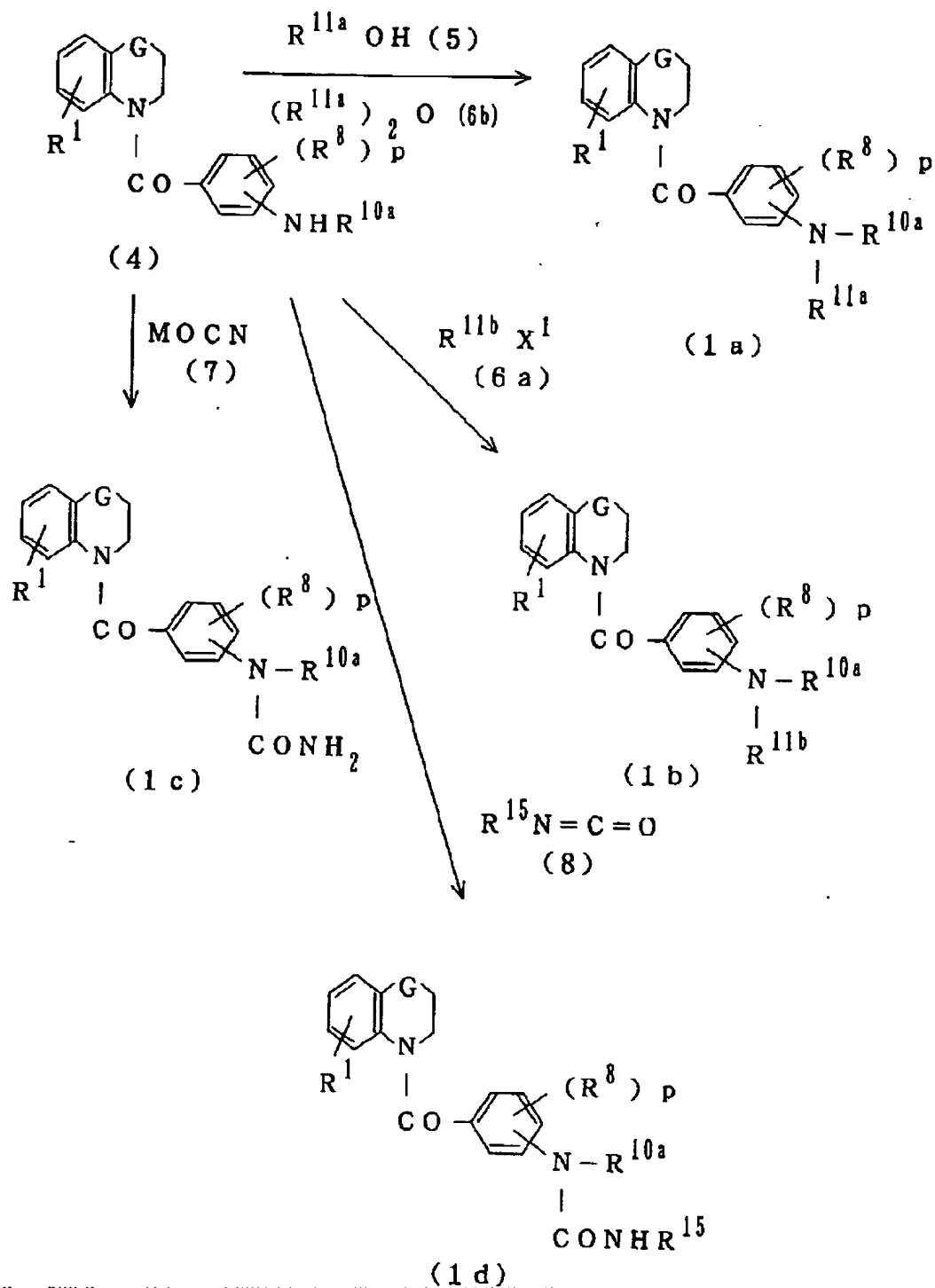
【0263】

[0263]

【化 29】

[Chemical Formula 29]

反応式 - 2

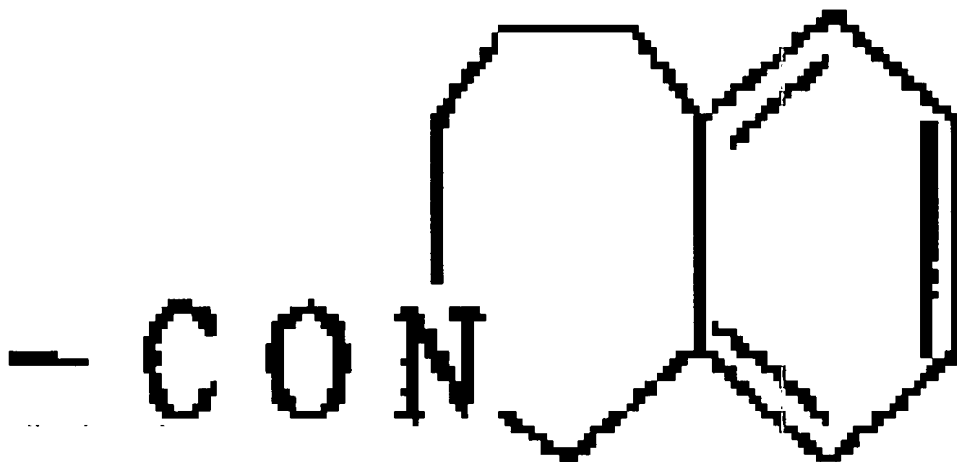


[0264]

[式中 G、p、R¹、R²、R³、R⁸ 及び X は前記に同じ。R^{10a} は、水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R^{11a} は、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、基]

[0265]

[化 30]



[0266]

、フェノキシ低級アルコシカルボニル基、キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、ピリジル低級アルコシカルボニル基、フルオレニル低級アルコシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、ピペリジン環上に置換基として低級ア

[0264]

{As for G, p, R¹, R², R³, R⁸ and X in Formula same to description above. R^{10a} shows lower alkanoyl group which has fact that it possesses the halogen atom as hydrogen atom, lower alkyl group or substituent. R^{11a} from group which becomes halogen atom and hydroxy group as the substituent on lower alkanoyl group, phenyl ring which has fact that it possesses group which is chosen as substituent are times when it possesses group which is chosen from group which becomes amino group, nitro group, lower alkanoyl group substituted amino group and halogen atom which have times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group, phenyl group, lower alkoxy group, halogen atom substituted lower alkyl group, substituent, At same time in lower alkanoyl portion phenoxy lower alkanoyl group, lower alkoxy-substituted lower alkanoyl group, lower alkanoyl oxy substitution lower alkanoyl group, basis which has times when it possesses halogen atom as substituent }

[0265]

[Chemical Formula 30]

[0266]

On phenoxy lower alkoxy carbonyl group, quinolyl carbonyl group, quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, quinoline ring from group which becomes lower alkyl group and oxo group as substituent lower alkoxy carbonyl group, benzo furil carbonyl group, benzoimidazolyl carbonyl group, tetrahydroisoquinolyl carbonyl group, phenyl lower alkoxy carbonyl group or phenyl lower alkenyl carbonyl group which has times when it possesses halogen atom as bipyridinyl lower alkoxy carbonyl group, substituent which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes

ルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル低級アルケニルカルボニル基を示す。

R^{11b} は、低級アルキル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、置換基として低級アルキル基、ピリジニル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基又は低級アルキルスルホニル基を示す。

X¹ はハロゲン原子を示す。

M はナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。

R¹⁵ は低級アルキル基、ピリジニル低級アルキル基又はフェニル低級アルキル基を示す。

]

化合物(4)と化合物(5)の反応は前記反応式-1の化合物(2)と化合物(3)の反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0267】

化合物(4)と化合物(6a)の反応は、一般に適当な不活性溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下にて行なわれる。

用いられる不活性溶媒としては例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール等の低級アルコール類、酢酸、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

the lower alkanoyl group, lower alkoxy carbonyl group and lower alkyl group as substituent is shown on tetrahydroquinolyloxy substitution lower alkanoyl group, pyridyl lower alkoxy carbonyl group, fluorenyl lower alkoxy carbonyl group, lower alkenyl oxycarbonyl group, tetrahydro naphthyloxy substitution lower alkanoyl group, piperidine ring which has times when it possesses the group which is chosen.

R^{11b} on lower alkyl group, cycloalkyl group, phenyl ring are times when it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and halogen atom as the substituent, At same time on phenyl lower alkyl group, phenyl ring which has times when it possesses hydroxy group in lower alkyl group portion amino carbonyl group, benzoyl lower alkyl group or lower alkyl sulfonyl group which has times when it possesses group which is chosen is shown from group which becomes lower alkyl group, pyridyl lower alkyl group and phenyl lower alkyl group as phenoxy lower alkyl group, substituent which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent.

X¹ shows halogen atom.

M shows sodium, potassium or other alkali metal.

R¹⁵ shows lower alkyl group, pyridyl lower alkyl group or phenyl lower alkyl group.

)

compound (4) with reaction of compound (5) can do compound of the aforementioned reaction scheme -1 (2) with under condition which is similar to the reaction of compound (3).

【0267】

compound (4) with reaction of compound (6a), in suitable inert solvent, is done generally with presence or absence of basic compound.

for example benzene, toluene, xylene or other aromatic hydrocarbons, tetrahydrofuran, dioxane, diethylene glycol dimethyl ether or other ethers, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride or other halogenated hydrocarbons, methanol, ethanol, isopropanol, butanol, t-butanol or other lower alcohols, acetic acid, ethylacetate, acetone, acetonitrile, pyridine, dimethyl sulfoxide, dimethylformamide, hexamethyl phosphoric acid triamide or these mixed solvent etc can be listed as inert solvent which is used.

また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート、ピリジン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基等を挙げることができる。

化合物(4)と化合物(6a)との使用割合としては、特に限定がなく広い範囲で適宜選択すればよいが、前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~10 倍モル量程度用いるのがよい。

該反応は通常 0~200 deg C 程度、好ましくは 0~170 deg C 程度にて行なわれ、一般に 30 分~75 時間程度で反応は終了する。

該反応系内には沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物、銅粉等を添加してもよい。

【0268】

化合物(4)と化合物(6b)の反応は、後記反応式-9における化合物(1t)と化合物(18)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0269】

化合物(4)と化合物(7)との反応は、酸の存在下、適当な溶媒中で行なわれる。

ここで使用される酸としては、例えば、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、塩酸、硫酸等の鉱酸等を挙げることができる。

使用される溶媒としては、前記反応式-1 のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。

化合物(7)の使用量は、化合物(4)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル~3 倍モル量程度とするのがよい。

該反応は、通常 0~150 deg C、好ましくは室温~100 deg C 付近にて行なわれ、通常 10 分~5 時間程度にて反応は終了する。

【0270】

化合物(4)と化合物(8)との反応は、塩基性化合物

In addition for example sodium carbonate , potassium carbonate , sodium hydrogen carbonate , potassium hydrogen carbonate or other carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide or other metal hydroxide , sodium hydride , potassium , sodium , sodium amide , sodium methylate , sodium ethylate or other metal alcoholate , pyridine , N-ethyldiisopropylamine , dimethylamino pyridine , triethylamine , 1, 5-diazabicyclo {4.3 . 0} nonene -5 (DBN) , 1 and 8 -diazabicyclo {5.4 . 0} undecene -7 (DBU) , 1 and 4 -diazabicyclo {2.2 . 2} octane (DABCO) or other organic base etc can be listed as basic compound .

compound (4) with compound (6 a) with as portion used , if there is notespecially limitation and should have selected appropriately in widerange, but it is good equimolar amount extent and preferably equimole ~10 times molar amount extent to use the latter at least, vis-a-vis former .

said reaction is done at usually 0 - 200 deg C extent and preferably 0~170deg C extent, reaction ends generally at 30 minute - 75 hour extent.

It is possible to add sodium iodide , potassium iodide or other alkali metal halogen compound , copper powder etc inside said reaction system .

【0268】

compound (4) with as for reaction of compound (6 b) , compound in thepostscript reaction scheme -9 (1 t) with it is possible to be done under condition which is similar to reaction of compound (18).

【0269】

compound (4) with compound (7) with reaction, is done under existingof acid and in suitable solvent .

for example acetic acid , trifluoroacetic acid or other organic acid , hydrochloric acid , sulfuric acid or other mineral acid etc can be listed as acid which is used here.

solvent which is used with method which amine (2) reacts to carboxylic acid halide of aforementioned reaction scheme -1 as solvent which is used, canbe used in each case.

As for amount used of compound (7), it is good to make equimolar amount , preferably equimole ~3 times molar amount extentusually at least, vis-a-vis compound (4).

said reaction is done with usually 0 - 150 deg C, preferably room temperature ~100deg Cvicinity , reaction ends atusually 10 min ~5 hours extent.

【0270】

compound (4) with compound (8) with reaction, under

物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に、適当な溶媒中又は無溶媒下で行なわれる。

ここで使用される溶媒及び塩基性化合物は、前記反応式-1 のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

【0271】

化合物(8)の使用量としては、化合物(4)に対して通常等モル~5 倍モル量程度、好ましくは等モル~3 倍モル量程度とするのがよい。

該反応は通常 0~200 deg C 程度、好ましくは室温~150 deg C 程度付近の温度で、通常 5 分~30 時間程度を要して行なわれる。

該反応には三弗化ほう素エチルエーテル等の硼素化合物を添加してもよい。

【0272】

【化 31】

presence or absence, preferably absence of the basic compound, is done in suitable solvent or under solventless.

As for solvent and basic compound which are used here, solvent and the basic compound which are used with method which amine (2) reacts to the carboxylic acid halide of aforementioned reaction scheme -1 can be used in each case.

[0271]

As amount used of compound (8), it is good usually to make equimole ~5 times molar amount extent and preferably equimole ~3 times molar amount extent, vis-a-vis compound (4).

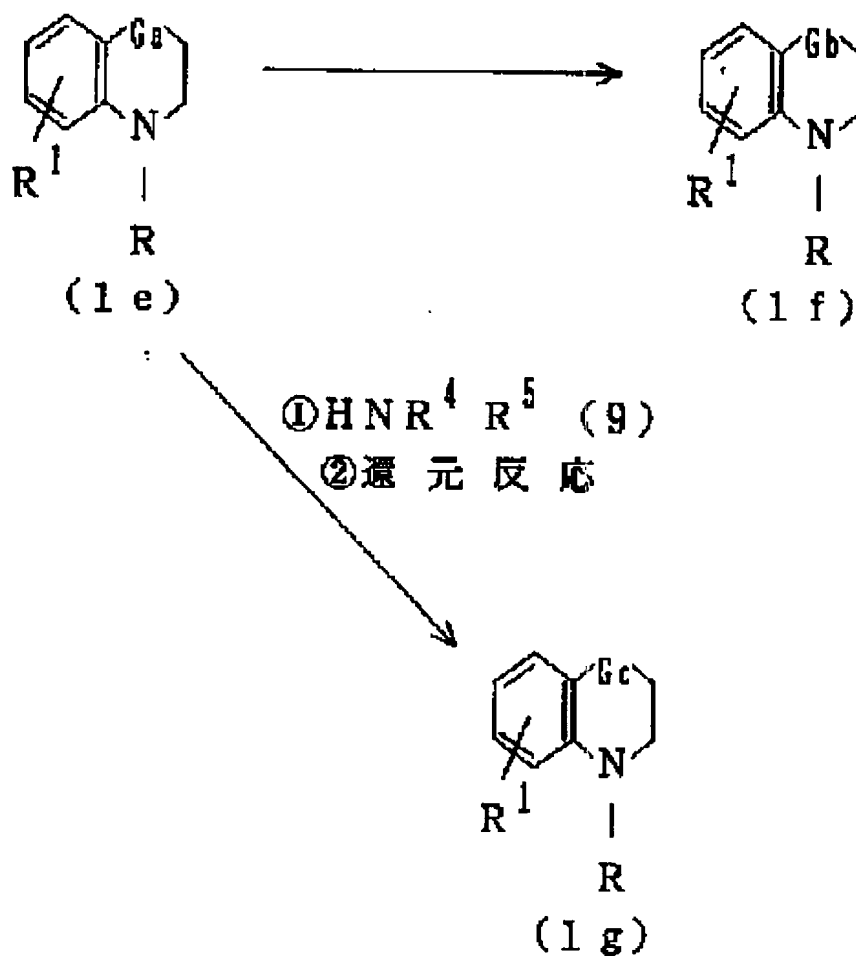
said reaction is done usually 0 - 200 deg C extent, with temperature of preferably room temperature ~150deg C extent vicinity, requiring usually 5 min ~30 time extent.

It is possible to add three fluoridation boron ethyl ether or other borohydride to said reaction.

[0272]

[Chemical Formula 31]

反応式 - 3



【0273】

〔式中 R^1 及び R は前記に同じ。Ga は〕

【0274】

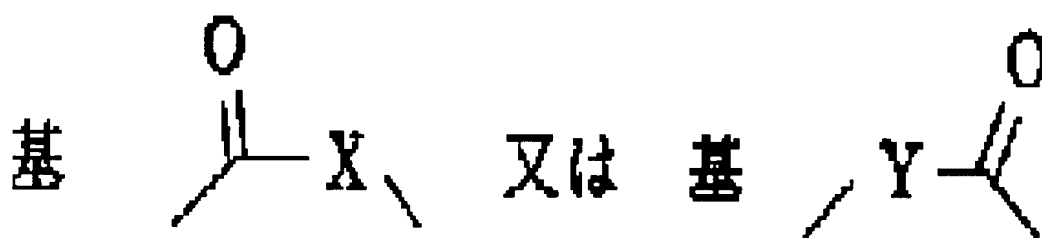
【化 32】

[0273]

{As for $R^{¹}$ and R in Formula same to description above. As for Ga }

[0274]

[Chemical Formula 32]



【0275】

を示す。

Gb は

【0276】

【化 33】

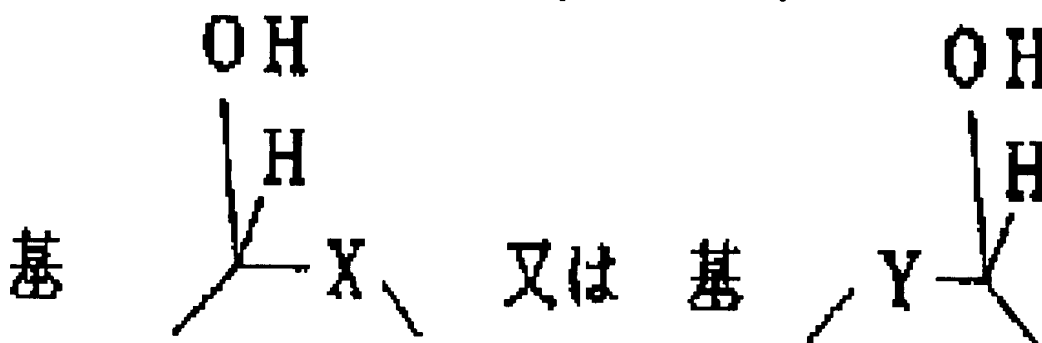
【0275】

It shows.

As for Gb

【0276】

[Chemical Formula 33]



【0277】

を示す。

Gc は

【0278】

【化 34】

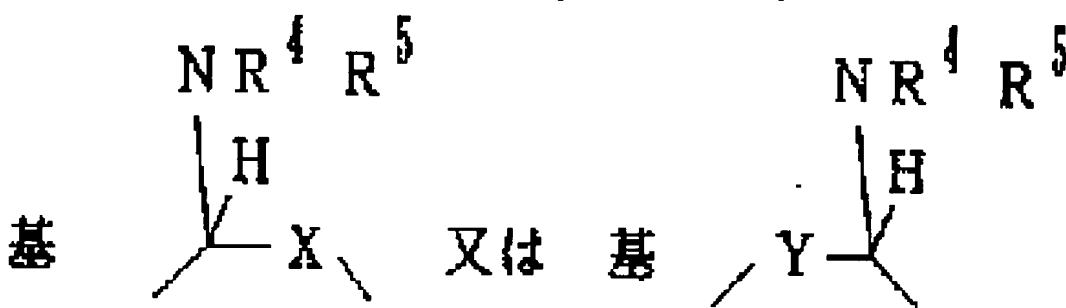
【0277】

It shows.

As for Gc

【0278】

[Chemical Formula 34]



【0279】

を示す。

【0279】

It shows.

ここで X、Y、R⁴ 及び R⁵ は前記に同じ。

]

化合物(1e)を化合物(1f)に導く反応は還元反応により行ない得る。

この還元反応には、水素化還元剤を用いる還元法が好適に利用される。

用いられる水素化還元剤としては、例えば水素化アルミニウムリチウム、水素化硼素リチウム、水素化硼素ナトリウム、ジボラン等が挙げられ、その使用量は原料化合物に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル~15 倍モルの範囲である。

この還元反応は、通常適当な溶媒、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグリム等のエーテル類やこれらの混合溶媒等を用い、通常約-60~150 deg C、好ましくは-30~100 deg Cにて、約 10 分間~15 時間程度で行なわれる。

尚、還元剤として水素化アルミニウムリチウムやジボランを用いた場合は、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグリム等の無水の溶媒を用いるのがよい。

【0280】

化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、脱水剤の非存在下又は存在下に行なわれる。

ここで使用される溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

脱水剤としては、例えばモレキュラーシーブ等の通常の溶媒の脱水に用いられる乾燥剤、塩酸、硫酸、三弗化ホウ素等の鉱酸、p-トルエンスルホン酸、酢酸等の有機酸等を挙げることができる。

該反応は、通常室温~250 deg C、好ましくは 50~200 deg C 程度にて行なわれ、一般に 1~48 時間程度で反応は終了する。

化合物(9)の使用量としては、特に制限されないが、通常化合物(1e)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~大過剰量使用するのが

Here as for X, Y, R⁴ and R⁵ same to description above.

)

It can do reaction which leads compound (1 e) to compound (1 f) with reduction reaction .

reduction method which uses hydrogenation and reduction agent is utilized ideally in this reduction reaction .

You can list for example lithium aluminum hydride , hydrogenation boron lithium , sodium borohydride , diborane etc as hydrogenation and reduction agent which is used, amount used is range of equimole , preferably equimole ~15 molar multiple at least vis-a-vis starting material compound .

this reduction reaction , with usually approximately - 60 - 150 deg C, preferably -30~100deg C, is done at approximately 10 min ~15 time extent usually suitable solvent , for example water, making use of methanol , ethanol , isopropanol or other lower alcohols , tetrahydrofuran , diethyl ether , diisopropyl ether , diglyme or other ethers and these mixed solvent etc.

Furthermore when lithium aluminum hydride and diborane are used as reductant , it is good to use solvent of tetrahydrofuran , diethyl ether , diisopropyl ether , diglyme or other anhydride .

【0280】

Reaction which leads compound (1 e) to compound (1 g) , is done in the solventless or suitable solvent , under absence of drying agent or under existing.

for example methanol , ethanol , isopropanol or other alcohols , benzene , toluene , xylene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , dichloroethane , chloroform , carbon tetrachloride or other halogenated hydrocarbons , dimethylformamide , dimethylacetamide , N-methyl pyrrolidone or other aprotic polar solvent or you can list these mixed solvent etc as solvent which is used here.

As drying agent , desiccant , hydrochloric acid , sulfuric acid , boron trifluoride or other mineral acid , p-toluenesulfonic acid , acetic acid or other organic acid etc which is used for dehydration of for example molecular sieve or other conventional solvent can be listed.

said reaction is done usually at room temperature ~250deg C, preferably 50~200deg C extent, reaction ends generally at 1 - 48 hour extent.

As amount used of compound (9), especially it is not restricted. Usually, it is good equimolar amount , preferably equimole ~large excess to use at least vis-a-vis compound (1

よい。

また脱水剤の使用量としては、乾燥剤の場合には通常大過剰量、酸を用いる場合には触媒量とするのがよい。

【0281】

引き続き還元反応には、種々の方法が適用でき、適当な溶媒中触媒の存在下、接触水素添加することにより行ない得る。

使用される溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒又は之等の混合溶媒等が挙げられる。

また使用される触媒としては、例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ランーニッケル等が挙げられる。

触媒は、原料化合物に対して一般に 0.02~1 倍量程度用いるのがよい。

反応温度は通常-20~100 deg C 付近、好ましくは 0~70 deg C 付近、水素圧は通常 1~10 気圧とするのがよく、該反応は一般に 0.5~20 時間程度で終了する。

【0282】

上記還元反応条件を利用できるが、好ましくは水素化還元剤を用いる還元法が好適に利用される。

用いられる水素化還元剤としては、例えば水素化アルミニウムリチウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウム、ジボラン等が挙げられ、その使用量は、通常化合物(1e)に対して少なくとも 0.1 倍モル、好ましくは 0.1 倍モル~10 倍モルの範囲である。

この還元反応は、通常適当な溶媒、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル類、ジメチルホルムアミド又はこれらの混合溶媒等を用い、通常約-60~50 deg C、好ましくは-30 deg C~室温にて、約 10 分間~5 時間程度で行なわれる。

なお、還元剤として水素化アルミニウムリチウムやジボランを用いた場合には、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジグライム等の無水の溶

e)。

In addition as amount used of drying agent, in case of desiccant when usually large excess, acid is used, it is good to make catalyst amount.

【0281】

Be able to apply to reduction reaction which continues, various methods, it can do under existing of catalyst in suitable solvent, by contact hydrogenation doing.

for example water, you can list acetic acid, methanol, ethanol, isopropanol or other alcohols, hexane, cyclohexane or other hydrocarbons, diethylene glycol dimethyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, diethyl ether or other ethers, ethylacetate, methyl acetate or other esters, dimethylformamide or other aprotic polar solvent or Itaru or other mixed solvent etc as the solvent which is used.

In addition you can list for example palladium, palladium-black and palladium-carbon, platinum, platinum oxide, copper chromite, raney nickel etc as catalyst which is used.

As for catalyst, generally 0.02 - 1 -fold amount it is good vis-a-vis the starting material compound to use.

As for reaction temperature as for usually - 20 - 100 deg C vicinity, preferably 0~70deg C vicinity, hydrogen pressure it is good to make usually 1 - 10 atmosphere, said reaction ends generally at 0.5 - 20 hours extent.

【0282】

Above-mentioned reduction reaction condition can be utilized, but reduction method which uses preferably hydrogenation and reduction agent is utilized ideally.

You can list for example lithium aluminum hydride, sodium borohydride, sodium cyanoborohydride, diborane etc as hydrogenation and reduction agent which is used, amount used is range of 0.1 molar multiple, preferably 0.1 molar multiple ~10 times mole at least usually vis-a-vis compound (1 e).

this reduction reaction, with usually approximately - 60 - 50 deg C, preferably -30deg C~room temperature, is done at approximately 10 min ~5 hours extent usually making use of suitable solvent, for example water and methanol, ethanol, isopropanol or other lower alcohols, tetrahydrofuran, diethyl ether, diglyme or other ethers, dimethylformamide or these mixed solvent etc.

Furthermore, when lithium aluminum hydride and diborane are used as reductant, it is good to use solvent of diethyl ether, tetrahydrofuran, diglyme or other anhydride.

媒を用いるのがよい。

ether, tetrahydrofuran, diglyme or other anhydride.

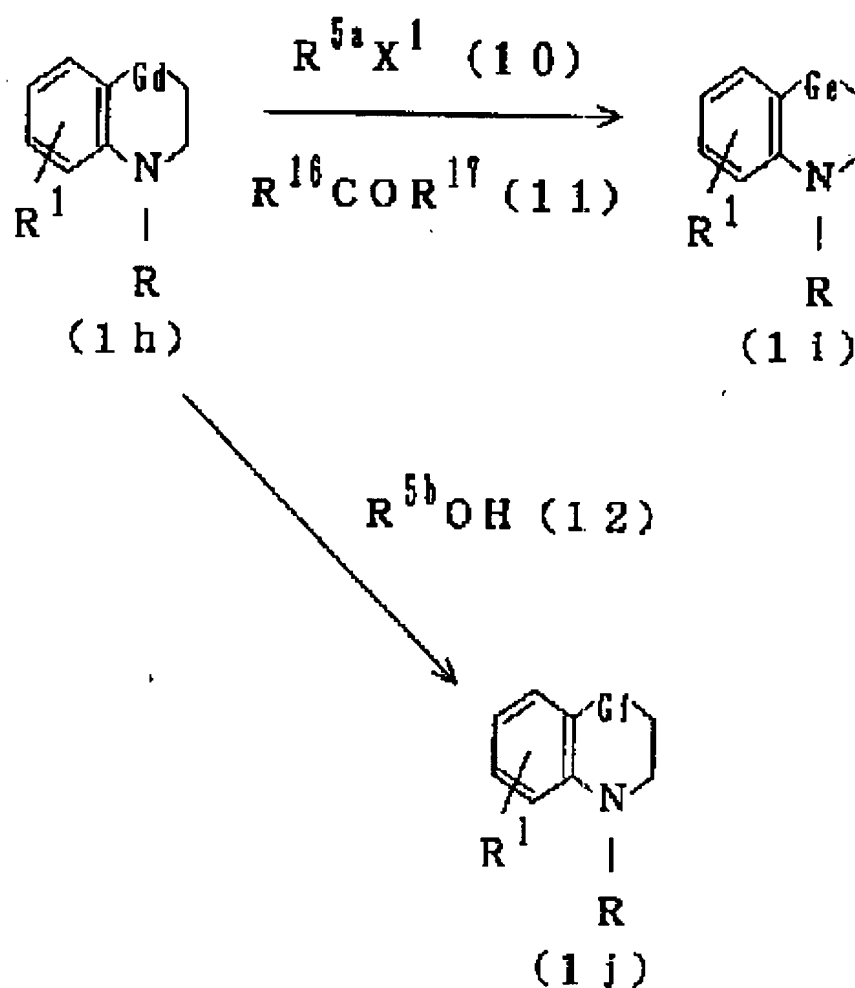
【0283】

[0283]

【化 35】

[Chemical Formula 35]

反応式- 4



【0284】

〔式中 R¹ 及び R は前記に同じ。R^{3a} は水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。R^{5a} は置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基を示す。R¹⁶ 及び R¹⁷ はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。R^{5b} は、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。Gd は〕

[0284]

{As for R¹ and R in Formula same to description above. R^{3a} shows hydrogen atom or hydroxy group substituted lower alkyl group. R^{5a} shows lower alkyl group which has fact that it possesses the hydroxy group as substituent. R¹⁶ and R¹⁷ show hydrogen atom or lower alkyl group respectively. R^{5b} shows benzoyl group which has fact that it possesses the halogen

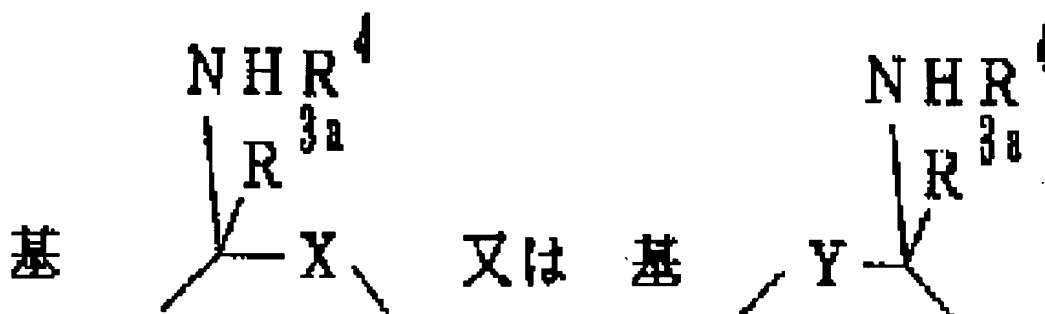
benzoyl group which has fact that it possesses the halogen atom as substituent on phenyl ring . As for Gd }

【0285】

【0285】

【化 36】

【Chemical Formula 36】



【0286】

【0286】

を示す。

It shows.

Ge は

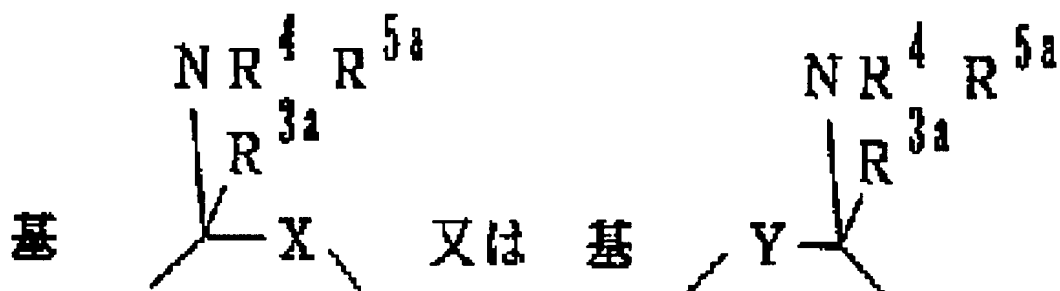
As for Ge

【0287】

【0287】

【化 37】

【Chemical Formula 37】



【0288】

【0288】

を示す。

It shows.

Gf は

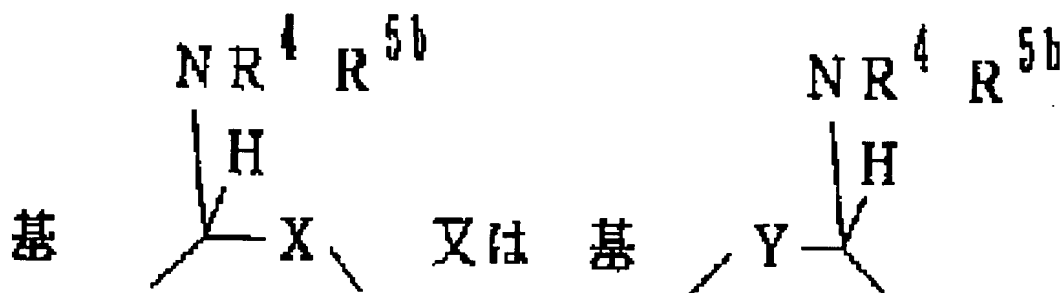
As for Gf

【0289】

【0289】

【化 38】

【Chemical Formula 38】



【0290】

を示す。

ここで X、Y、R⁴、R^{5a}、R^{3a} 及び R^{5b} は前記に同じ。

]

化合物(1h)と化合物(10)との反応は、前記反応式-2 における化合物(4)と化合物(6)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0291】

化合物(1h)と化合物(11)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行なわれる。

ここで使用される溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、アセトニトリル、ギ酸、酢酸、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライム、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、又は之等の混合溶媒を例示できる。

還元剤としては例えばギ酸、ギ酸アンモニウム、ギ酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル等の接触還元剤等を例示できる。

【0292】

還元剤としてギ酸を使用する場合、反応温度は通常室温~200 deg C 程度、好ましくは 50~150 deg C 程度付近が適当であり、反応は 1~10 時間程度にて終了する。

ギ酸の使用量は化合物(1h)に対して大過剰量使用するのがよい。

[0290]

It shows.

Here as for X, Y, R⁴, R^{5a}, R^{3a} and R^{5b} same to description above.

)

compound (1 h) with compound (10) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -2 (4) with it is possible to be done under condition which is similar to reaction of compound (6).

[0291]

compound (1 h) with compound (11) with reaction, is done in solventless or suitable solvent and under existing of reductant .

for example water, methanol, ethanol, isopropanol or other alcohols, acetonitrile, formic acid, acetic acid, dioxane, diethyl ether, diglyme, tetrahydrofuran or other ethers, benzene, toluene, xylene or other aromatic hydrocarbons, or Itaru or other mixed solvent can be illustrated as the solvent which is used here.

for example formic acid, ammonium formate, sodium formate or other aliphatic acid alkali metal salt, sodium borohydride, sodium cyanoborohydride, lithium aluminum hydride or other hydrogenation and reduction agent, palladium - black and palladium -carbon, platinum oxide, platinum black, raney nickel or other catalytic reduction agent etc can be illustrated as reductant .

[0292]

When formic acid is used as reductant, as for reaction temperature usually room temperature ~200deg C extent, preferably 50~150deg C extent vicinity being suitable, as for reaction it endsat 1 - 10 hours extent.

amount used of formic acid large excess using is good vis-a-vis compound (1 h).

[0293]

また水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常-30~100 deg C 程度、好ましくは 0~70 deg C 程度が適当であり、30 分~12 時間程度で反応は完結する。

還元剤の使用量は、化合物(1h)に対して通常等モル~20 倍モル量程度、好ましくは 1~6 倍モル量程度とするのがよい。

特に還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。

[0294]

更に接触還元剤を用いる場合は、通常常圧~20 気圧程度、好ましくは常圧~10 気圧程度の水素雰囲気中で、又はギ酸、ギ酸アンモニウム、シクロヘキセン、抱水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30~100 deg C 程度、好ましくは 0~60 deg C 程度の温度で反応を行なうのがよく、通常 1~12 時間程度で反応は終了する。

接触還元剤の使用量としては化合物(1h)に対して通常 0.1~40 重量%、好ましくは 1~20 重量%程度とするのがよい。

水素供与剤の使用量としては化合物(1h)に対して通常大過剰量とするのがよい。

[0295]

また化合物(11)の使用量としては化合物(1h)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル~大過剰量とするのがよい。

[0296]

化合物(1h)と化合物(12)との反応は、前記反応式-1 における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の反応条件下に行ない得る。

[0297]

[化 39]

[0293]

In addition when hydrogenation and reduction agent is used, as for reaction temperature usually - 30 - 100 deg C being extent and preferably 0~70deg C extent suitable, reaction completes at 30 minute - 12 hour extent.

As for amount used of reductant, it is good usually to make equimole ~20 times molar amount extent and preferably 1~6-fold molar amount extent, vis-a-vis compound (1 h).

Especially when lithium aluminum hydride is used as reductant, it is desirable to use diethyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, diglyme or other ethers, benzene, toluene, xylene or other aromatic hydrocarbons as solvent.

[0294]

Furthermore when catalytic reduction agent is used, usually in hydrogen atmosphere of ambient pressure ~20atmosphere extent and preferably ambient pressure ~10atmosphere extent, or under existing of formic acid, ammonium formate, cyclohexene, hydrazine hydrate or other hydrogen provision agent, usually - it is good to react with temperature of 30 - 100 deg C extent and preferably 0~60deg C extent, reaction ends at usually 1 - 12 hour extent.

As amount used of catalytic reduction agent it is good to make usually 0.1 - 40 weight %, preferably 1~20weight % extent, vis-a-vis compound (1 h).

As amount used of hydrogen provision agent it is good usually to make large excess, vis-a-vis compound (1 h).

[0295]

In addition as amount used of compound (11) it is good to make equimolar amount, preferably equimole ~large excess usually at least, vis-a-vis compound (1 h).

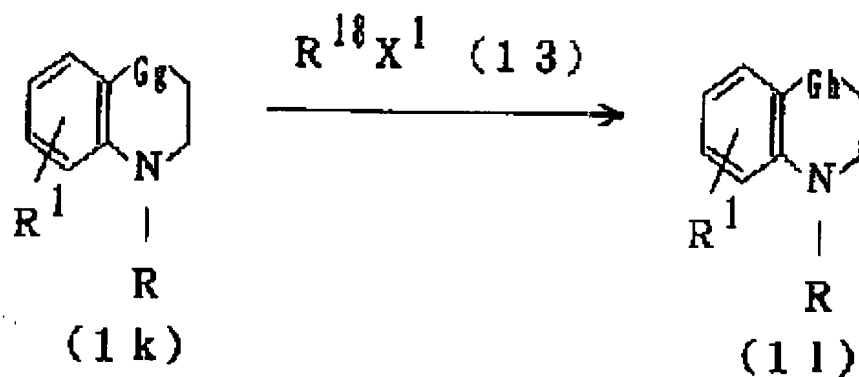
[0296]

compound (1 h) with compound (12) with as for react, compound in the aforementioned reaction scheme -1 (2) with compound (3) with it can under reaction condition which is similar to reaction.

[0297]

[Chemical Formula 39]

反応式～ 5



【0298】

【式中 R¹、R^{3a}、R、X 及び X¹ は、前記に同じ。
Gg は】

【0299】

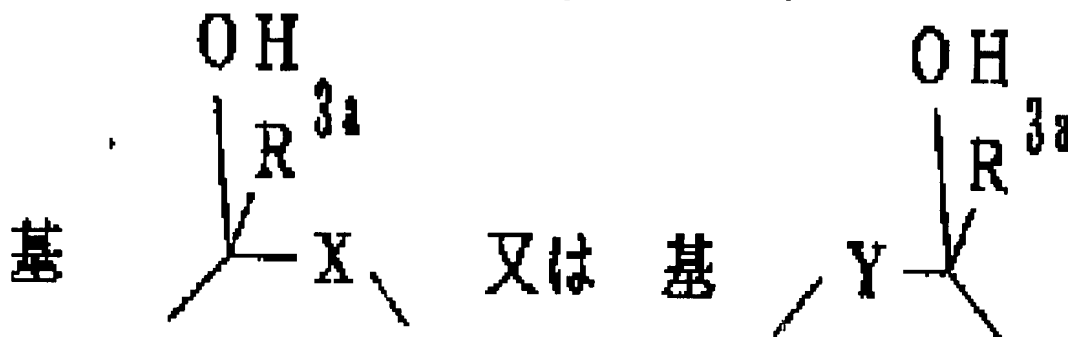
【化 40】

[0298]

{As for R¹, R^{3a}, R, X and X¹ in
Formula, same to description above. As for Gg }

[0299]

[Chemical Formula 40]



【0300】

を示す。

Gh は

【0301】

【化 41】

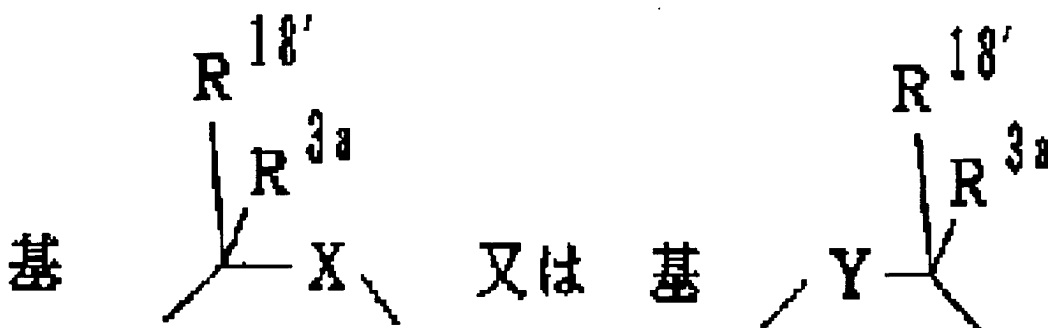
[0300]

It shows.

As for Gh

[0301]

[Chemical Formula 41]



【0302】

を示す。

ここで X、Y 及び R^{3a} は前記に同じ。

R^{18'} は、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は基-O-ACONR⁶R⁷(A、R⁶ 及び R⁷ は前記に同じ。)を示す。

R¹⁸ は、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル基、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルキル基、カルボキシ基置換低級アルキル基又は基-ACONR⁶R⁷(A、R⁶ 及び R⁷ は前記に同じ。)を示す。

]

化合物(1k)と化合物(13)との反応は、前記反応式-2 における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0303】

【化 42】

[0302]

It shows.

Here as for X, Y and R^{3a} same to description above.

R^{18'} amino substitution lower alkanoyl oxy group, lower alkoxy group, lower alkoxy carbonyl group substitution lower alkoxy group, carboxyl substitution lower alkoxy group or basis which has times when it possesses lower alkyl group as substituent

-O-ACONR⁶R⁷ shows (As for A, R⁶ and R⁷ same to description above.).

R¹⁸ amino substitution lower alkanoyl group, lower alkyl group, lower alkoxy carbonyl group substituted lower alkyl group, carboxyl substituted lower alkyl group or basis which has the times when it possesses lower alkyl group as substituent -ACONR⁶R⁷ shows (As for A, R⁶ and R⁷ same to description above.).

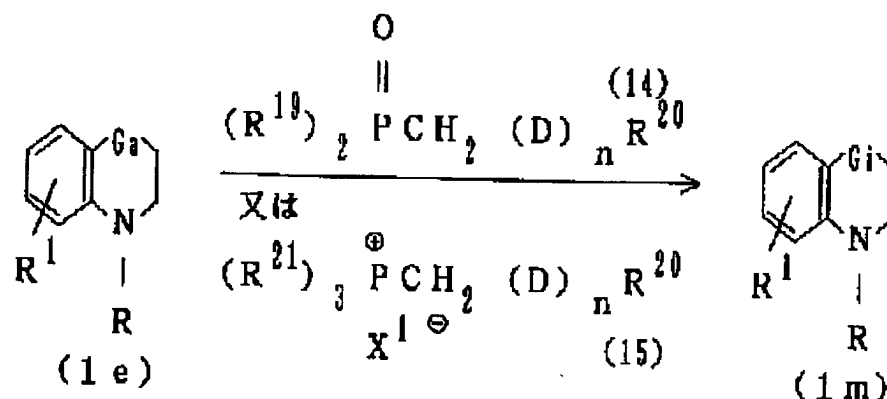
)

compound (1 k) with compound (13) with as for reaction, compound in the aforementioned reaction scheme -2 (4) with compound (6 a) with it is possible to be done under condition which is similar to reaction.

[0303]

[Chemical Formula 42]

反応式- 6



【0304】

〔式中 R¹、R、X¹ 及び Ga は前記に同じ。Gi は〕

【0304】

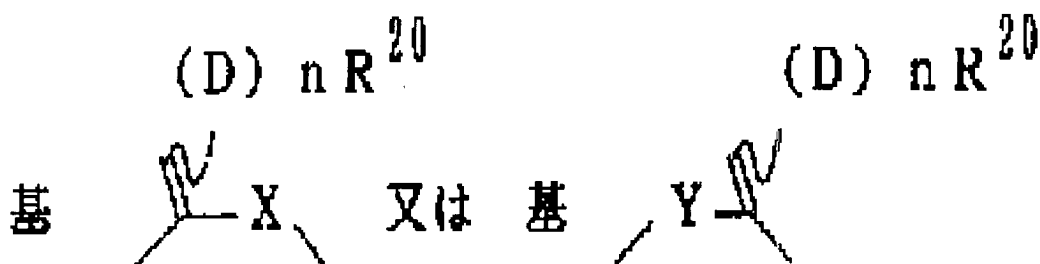
{As for R¹, R, X¹ and Ga in Formula same to description above. As for Gi }

【0305】

【化 43】

【0305】

[Chemical Formula 43]



【0306】

を示す。

X 及び Y は前記に同じ。

R¹⁹ は低級アルコキシ基を示す。R²⁰ は水素原子、低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ基又はフェニル基を示す。

D は低級アルキレン基を示す。

n は 0 又は 1 を示す。

R²¹ はフェニル基を示す。

〕

化合物(1e)と化合物(14)又は(15)との反応は塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行なわ

【0306】

It shows.

As for X and Y same to description above.

R¹⁹ shows lower alkoxy group .R²⁰ shows hydrogen atom , lower alkoxy carbonyl group , lower alkoxyl or phenyl group .

D shows lower alkylene group .

n shows 0 or 1 .

R²¹ shows phenyl group .

)

compound (1 e) with compound (14) or (15) with reaction is done underexisting of basic compound and in suitable

れる。

用いられる塩基性化合物としては、金属ナトリウム、金属カリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウム t-ブトキシド等の金属アルコール類、メチルリチウム、n-ブチルリチウム、フェニルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等のアルキル及びアリールリチウム又はリチウムアミド類、ピリジン、ピペリジン、キノリン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等の有機塩基等を例示できる。

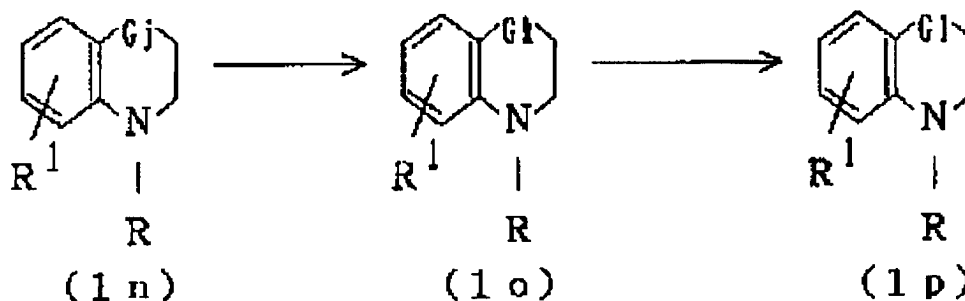
溶媒としては、反応に影響を与えないものであればいずれも使用できるが、例えばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、n-ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ピリジン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類等が挙げられる。

反応温度は、通常-80~150 deg C、好ましくは-80~120 deg C 付近とするのがよく、一般に0.5~15 時間程度で反応は終了する。

【0307】

【化 44】

反応式 - 7



【0308】

【式中 R¹ 及び R は前記に同じ。Gj は】

solvent .

metallic sodium , metal potassium , sodium hydride , sodium amide , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium carbonate , potassium carbonate , sodium hydrogen carbonate or other inorganic base , sodium methylate , sodium ethylate , potassium t-butoxide or other metal alcoholate , methyl lithium , n- butyl lithium , phenyl lithium , lithium diisopropyl amide or other alkyl and aryl lithium or lithium amides , pyridine , piperidine , quinoline , triethylamine , N, N- dimethyl aniline or other organic base etc can be illustrated as basic compound which is used.

As solvent , if it is something which does not produce effect on reaction , in each case can use , but you can list for example diethyl ether , dioxane , tetrahydrofuran , monoglyme , diglyme or other ethers , benzene , toluene , xylene or other aromatic hydrocarbons , n- hexane , heptane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , pyridine , N, N- dimethyl aniline or other amines , N, N- dimethylformamide , dimethyl sulfoxide , hexamethyl phosphoric acid triamide or other aprotic polar solvent , methanol , ethanol , isopropanol or other alcohols etc.

As for reaction temperature , it is good usually - to make 80 - 150 deg C , preferably -80~120deg C vicinity , reaction ends generally at 0.5 - 15 hour extent.

【0307】

【Chemical Formula 44】

【0308】

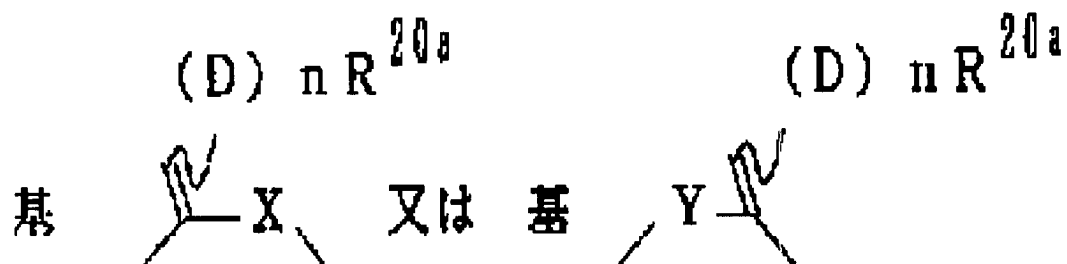
{ As for R¹ and R in Formula same to description above. As for Gj }

[0309]

【化 45】

[0309]

[Chemical Formula 45]



[0310]

を示す。

Gk は

[0311]

【化 46】

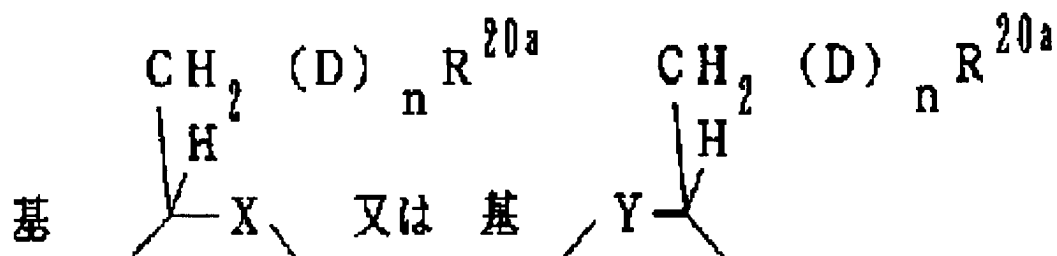
[0310]

It shows.

As for Gk

[0311]

[Chemical Formula 46]



[0312]

を示す。

Gl は

[0313]

【化 47】

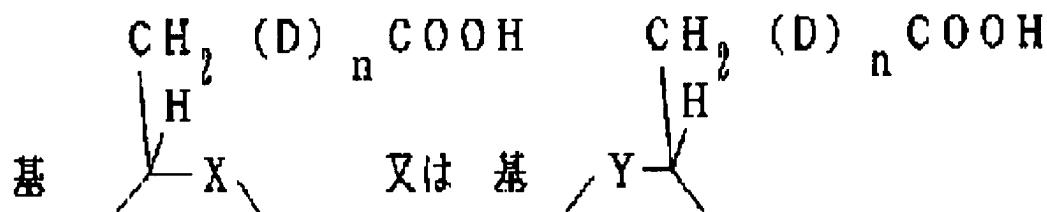
[0312]

It shows.

As for Gl

[0313]

[Chemical Formula 47]



[0314]

を示す。

[0314]

It shows.

ここで X、Y、D 及び n は前記に同じ。

R^{20a} は低級アルコキシカルボニル基を示す。

]

化合物(1n)を化合物(1o)に導く反応は、前記反応式-3 における化合物(1e)を化合物(1g)に導く場合の還元反応条件と同様の条件下に行なわれる。

該還元反応で水素還元剤を用いる還元法を利用するときには、該反応系内に塩化ニッケル等の金属ハロゲン化物を加えると反応は有利に進行する。

[0315]

また金属マグネシウム-メタノールを用いて化合物(1n)を還元することによっても、化合物(1o)に導くことができる。

この反応は、通常 0~50 deg C、好ましくは 0 deg C~室温付近にて行なわれ、一般に 1~10 時間程度で反応は完結する。

金属マグネシウムは、化合物(1n)に対して通常等モル~10 倍モル、好ましくは等モル~7 倍モル量使用するのがよい。

X がメチレン基を示す化合物(1n)の場合には、上記反応条件下で X がメチレン基である化合物(1o)に加えて、X が基=CH-である化合物も生成するが、これらの化合物は容易に分離される。

[0316]

化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下を実施することができる。

用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸、ギ酸等の脂肪酸類、之等の混合溶媒等を挙げることができる。

酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。

Here as for X, Y, D and n same to description above.

R^{20a} shows lower alkoxy carbonyl group .

)

As for reaction which leads compound (1 n) to compound (1 o), it is done under condition which is similar to reduction reaction condition when compound (1 e) in aforementioned reaction scheme -3 is led to compound (1 g).

When utilizing reduction method which uses hydrogen reduction agent with said reduction reaction , when the nickel chloride or other metal halide is added inside said reaction system , it advances reaction profitably.

[0315]

In addition, it is possible even by fact that compound (1 n) is reduced making use of metal magnesium -methanol to lead to compound (1 o).

this reaction is done with usually 0 - 50 deg C, preferably 0 deg C~room temperature vicinity , reaction completes generally at 1 - 10 hours extent.

As for metal magnesium , it is good usually equimole ~10 times mole , preferably equimole ~7 times molar amount to use vis-a-vis the compound (1 n).

When it is a compound (1 n) where X shows methylene group , X basis=CH- forms also compound which is in addition to compound (1 o) where X is methylene group under above-mentioned reaction condition ,, but these compound can be separated easily.

[0316]

With in or solventless suitable solvent , it can execute reaction which leads compound (1 o) to compound (1 p), under existing of acid or base characteristic compound .

for example water and methanol , ethanol , isopropanol or other lower alcohols , acetone , methylethyl ketone or other ketones , dioxane , tetrahydrofuran , ethyleneglycol dimethyl ether or other ethers , acetic acid , formic acid or other fatty acids , Itaru or other mixed solvent etc can be listed as the solvent which is used.

It can list for example hydrochloric acid , sulfuric acid , hydrobromic acid or other mineral acid and formic acid , acetic acid , aromatic sulfonic acid or other organic acid etc as acid , in addition as basic compound , for example sodium carbonate , potassium carbonate or other metal carbonate and sodium hydroxide , potassium hydroxide , calcium hydroxide , lithium hydroxide or other metal hydroxide etc it can list.

該反応は、通常室温~200 deg C 程度、好ましくは室温~150 deg C 程度にて好適に進行し、一般に 10 分~25 時間程度で終了する。

【0317】

また化合物(1p)は、化合物(1o)を、適当な溶媒中、ジメチルスルフィド-塩化アルミニウム等のジアルキルスルフィド-ルイス酸の存在下に処理することによっても製造される。

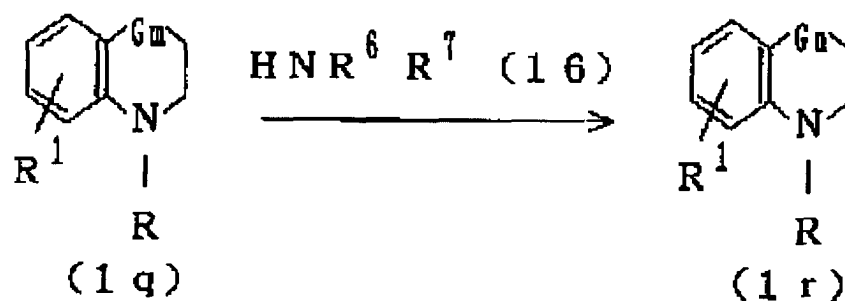
溶媒としては、前記反応式-2 における化合物(4)と化合物(6a)との反応で用いられる溶媒をいずれも使用できる。

この処理は、通常 0~70 deg C、好ましくは 0~50 deg C 付近で、1~10 時間行なえばよい。

【0318】

【化 48】

反応式 - 8



【0319】

【式中 R¹ 及び R は前記に同じ。Gm は】

【0320】

【化 49】

It advances said reaction, usually ideally at room temperature ~200deg C extent, and preferably room temperature ~150deg C extent ends generally at 10 min ~25 time extent.

【0317】

In addition compound (1 p) is produced even by fact that compound (1 o), is treated in suitable solvent and under existing of dimethyl sulfide -aluminum chloride or other dialkyl sulfide -Lewis acid .

As solvent , compound in aforementioned reaction scheme -2 (4) with compound (6 a) with solvent which is used with reaction can be used in eachcase.

this treatment, with usually 0 - 70 deg C, preferably 0~50deg Cvicinity , 1 - 10 hours it shouldhave done.

【0318】

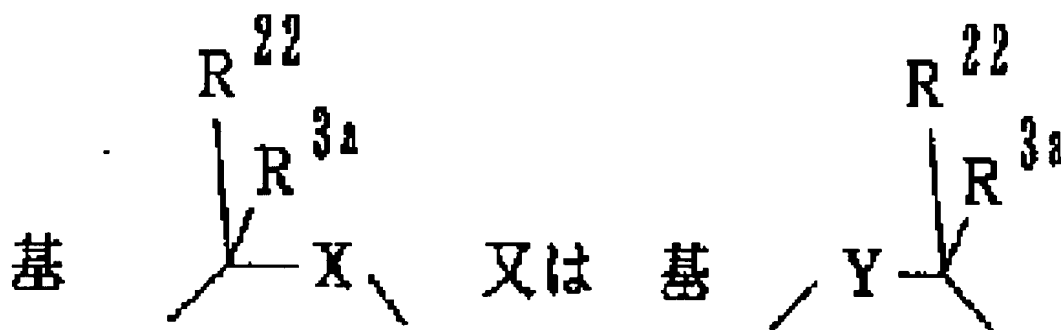
[Chemical Formula 48]

【0319】

{As for R¹ and R in Formula same to description above. As for Gm }

【0320】

[Chemical Formula 49]



【0321】

を示す。

Gn は

【0322】

【化 50】

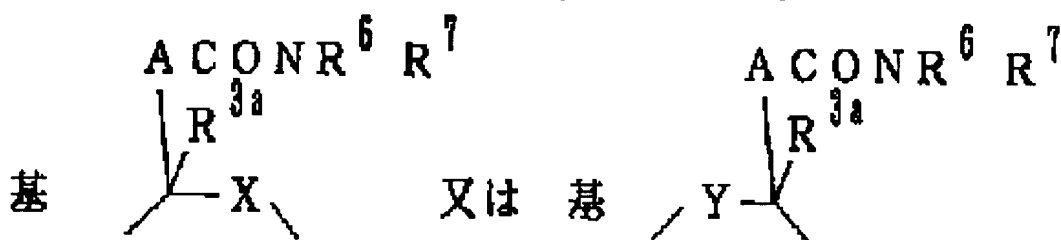
【0321】

It shows.

As for Gn

【0322】

【Chemical Formula 50】



【0323】

を示す。

R²² はカルボキシ置換低級アルキル基を示す。R^{3a}、R⁶、R⁷、A、X 及び Y は前記に同じ。

]

化合物(1q)と化合物(16)との反応は前記反応式-1 における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0324】

【化 51】

【0323】

It shows.

R²² shows carboxy substituted lower alkyl group .

As for R^{3a}, R⁶, R⁷, A, X and Y same to description above.

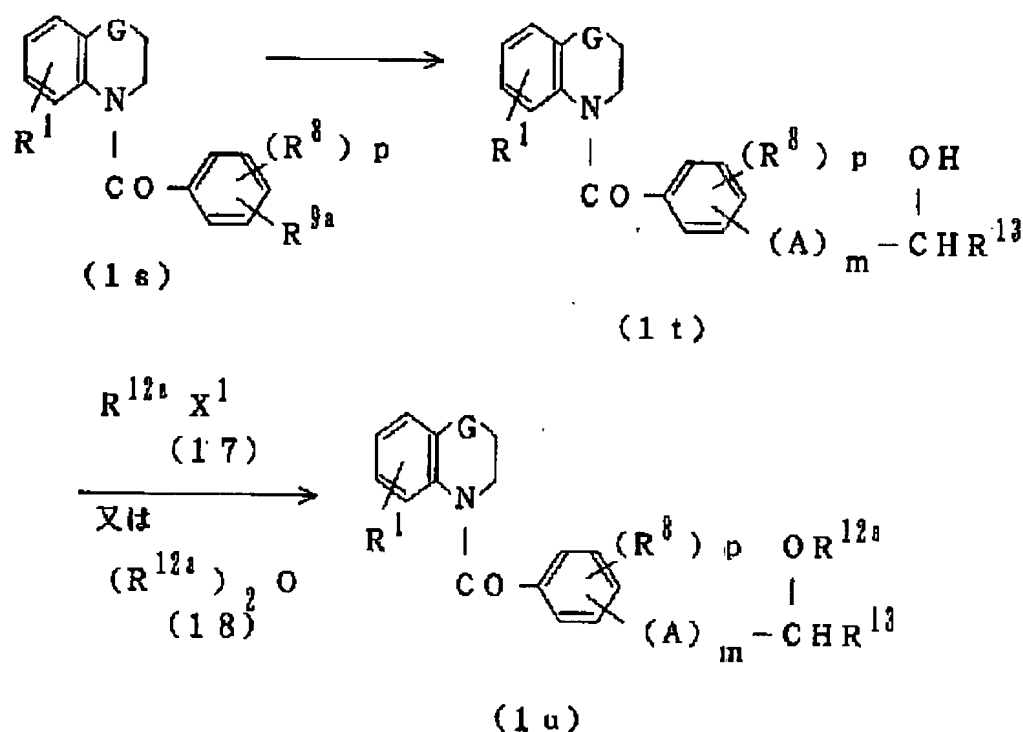
)

compound (1 q) with compound (16) with as for reaction compound in theaforementioned reaction scheme -1 (2) with compound (3) with it is possible to bedone under condition which is similar to reaction.

【0324】

【Chemical Formula 51】

反応式- 9



【0325】

〔式中 G、p、R¹、R⁸、X¹、A、m 及び R¹³ は前記に同じ。R^{9a} は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基を示す。R^{12a} は低級アルカノイル基を示す。〕

化合物(1s)を化合物(1t)に導く反応は、前記反応式-3 における化合物(1e)を化合物(1f)に導く反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0326】

化合物(1t)と化合物(17)との反応は、前記反応式-2 における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0325】

{As for G, p, R¹, R⁸, X¹, A, m and R¹³ in Formula same to description above. R^{9a} on phenyl ring on benzoyl group, phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent shows benzoyl lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent on phenyl lower alkanoyl group or phenyl ring which has times when it possesses lower alkyl group as substituent. R^{12a} shows lower alkanoyl group. }

As for reaction which leads compound (1 s) to compound (1 t), it is possible to do under condition which is similar to reaction which leads compound (1 e) in aforementioned reaction scheme -3 to compound (1 f).

【0326】

compound (1 t) with compound (17) with as for reaction, compound in the aforementioned reaction scheme -2 (4) with compound (6 a) with it is possible to do under condition

同様の条件下に行なうことができる。

【0327】

化合物(1t)と化合物(18)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下もしくは非存在下、好ましくは存在下に行なわれる。

ここで適当な溶媒としては例えば前述した芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール等の低級アルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の他、クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭化水素類、アセトン、ピリジン等を使用できる。

塩基性化合物としては例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等を例示できる。

上記反応はまた酢酸等の溶媒中、硫酸等の鉱酸の存在下を実施することもできる。

【0328】

化合物(18)の使用割合は出発原料に対して等モル量~大過剰量とすればよく、反応は通常 0~200 deg C 程度、好ましくは 0~150 deg C 程度下に、0.5~20 時間程度で完結する。

【0329】

出発原料としての化合物(2a)は、例えば下記反応式により製造されることができる。

【0330】

【化 52】

which is similar to reaction.

[0327]

compound (1 t) with compound (18) with reaction, is done in solventless or suitable solvent, under existing of basic compound or under absence and under preferably existing.

for example aromatic hydrocarbons, methanol, ethanol, propanol or other lower alcohols, dimethylformamide, dimethyl sulfoxide or other other things and chloroform, methylene chloride or other halogenated hydrocarbons, acetone, pyridine etc which are mentioned earlier can be used here as suitable solvent.

for example triethylamine, pyridine or other organic base, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride etc can be illustrated as basic compound.

In addition as for above-mentioned reaction it is possible also to execute in acetic acid or other solvent and under existing of sulfuric acid or other mineral acid.

[0328]

portion used of compound (18) vis-a-vis starting material if equimolar amount ~large excess it should have made, reaction under usually 0 - 200 deg C extent and preferably 0~150deg C extent, completes at 0.5 - 20 hour extent.

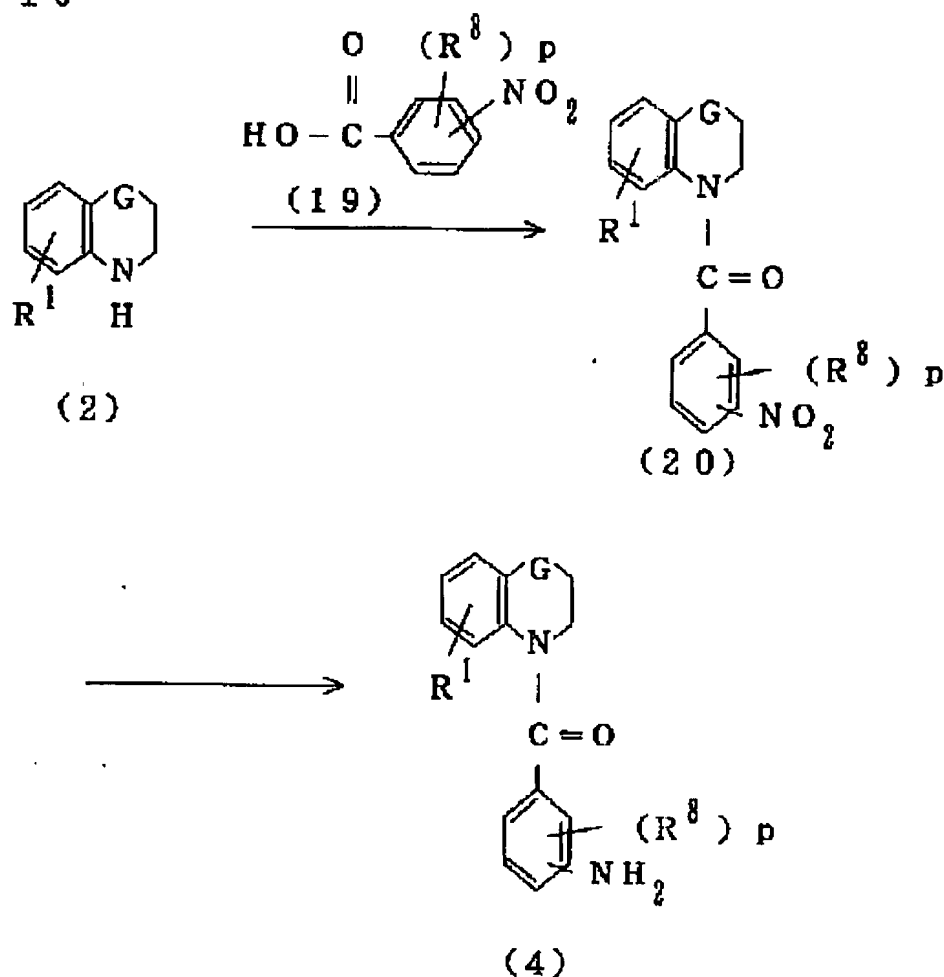
[0329]

To be produced by for example below-mentioned reaction scheme it is possible the compound (2 a) as starting material.

[0330]

[Chemical Formula 52]

反応式-10



【0331】

〔式中 G、p、 R^1 及び R^8 は前記に同じ。〕

化合物(2)と化合物(19)との反応は、前記反応式-1 における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0332】

化合物(20)を化合物(4)に導く反応は、例えば(1) 適当な溶媒中接触還元触媒を用いて還元するか又は(2) 適当な不活性溶媒中、金属もしくは金属塩と酸又は金属もしくは金属塩とアルカリ金属水酸化物、硫化物、アンモニウム塩等との混合物等を還元剤として用いて還元することによ

【0331】

{As for G, p, $R^{1\text{sup}}$ and $R^{8\text{sup}}$ in Formula same to description above. }

compound (2) with compound (19) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -1 (2) with compound (3) with it is possible to bedone under condition which is similar to reaction.

【0332】

Reaction which leads compound (20) to compound (4) reduces makinguse of catalytic reduction catalyst in for example (1) suitable solvent , or is done by reducing the acid or metal or metal salt and alkali metal hydroxide , sulfide , ammonium salt etc mixture etc in the(2) suitable inert solvent , metal or metal salt and as reductant using.

り行なわれる。

【0333】

(1)の還元触媒を用いる場合、使用される溶媒としては例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、N,N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒等又はこれらの混合溶媒等が挙げられ、使用される接触還元触媒としては例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネーニッケル等が挙げられる。

触媒は出発原料に対して一般に 0.02~1 倍量程度用いるのがよい。

反応温度は通常-20~150 deg C 付近、好ましくは 0~100 deg C 付近、水素圧は通常 1~10 気圧とするのがよく、該反応は一般に 0.5~10 時間程度で終了する。

また該反応には塩酸等の酸を添加してもよい。

【0334】

また(2)の方法を用いる場合、鉄、亜鉛、錫もしくは塩化第一錫と塩酸、硫酸等の鉱酸、又は鉄、硫酸第一鉄、亜鉛もしくは錫と水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物、硫化アンモニウム等の硫化物、アンモニア水、塩化アンモニウム等のアンモニウム塩との混合物が還元剤として用いられる。

使用される不活性溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、ジオキサン等を例示できる。

上記還元反応の条件としては、用いられる還元剤によって適宜選択すればよく、例えば塩化第一錫と塩酸とを還元剤として用いる場合、有利には 0~80 deg C 付近、0.5~10 時間程度反応を行なうのがよい。

還元剤は、原料化合物に対して少なくとも等モル量、通常は等モル~5 倍モル量用いられる。

【0335】

出発原料の(3)は例えば下記反応式により製造されることができる。

【0336】

solvent, metal or metal salt and as reductant using.

【0333】

When reducing catalyst of (1) is used, for example water and acetic acid, methanol, ethanol, isopropanol or other alcohols, hexane, cyclohexane or other hydrocarbons, dioxane, tetrahydrofuran, diethyl ether, diethylene glycol dimethyl ether or other ethers, ethylacetate, methyl acetate or other esters, N, N- dimethylformamide or other aprotic polar solvent etc or you can list these mixed solvent etc as solvent which is used, you can list for example palladium, palladium - black and palladium -carbon, platinum, platinum oxide, copper chromite, raney nickel etc as catalytic reduction catalyst which is used.

As for catalyst generally 0.02 - 1 -fold amount it is good vis-a-vis the starting material to use.

As for reaction temperature as for usually - 20 - 150 deg C vicinity, preferably 0~100deg C vicinity, hydrogen pressure it is good to make usually 1 - 10 atmosphere, said reaction ends generally at 0.5 - 10 hours extent.

In addition it is possible to add hydrochloric acid or other acid to said reaction.

【0334】

In addition when method of (2) is used, iron, zinc, tin or tin (II) chloride and mixture of hydrochloric acid, sulfuric acid or other mineral acid, or iron, iron (I) sulfate, zinc or tin and sodium hydroxide or other alkali metal hydroxide, ammonium sulfide or other sulfide, ammonia water, ammonium chloride or other ammonium salt it is used as reductant.

for example water and acetic acid, methanol, ethanol, dioxane etc can be illustrated as inert solvent which is used.

As condition of above-mentioned reduction reaction, if it should have selected appropriately with reductant which is used, when for example tin (II) chloride and hydrochloric acid it uses, as reductant profitably it is good to do 0 - 80 deg C vicinity, 0.5~10 hours extent reactions.

reductant equimolar amount, equimole ~5 times molar amount is usually used at least vis-a-vis the starting material compound.

【0335】

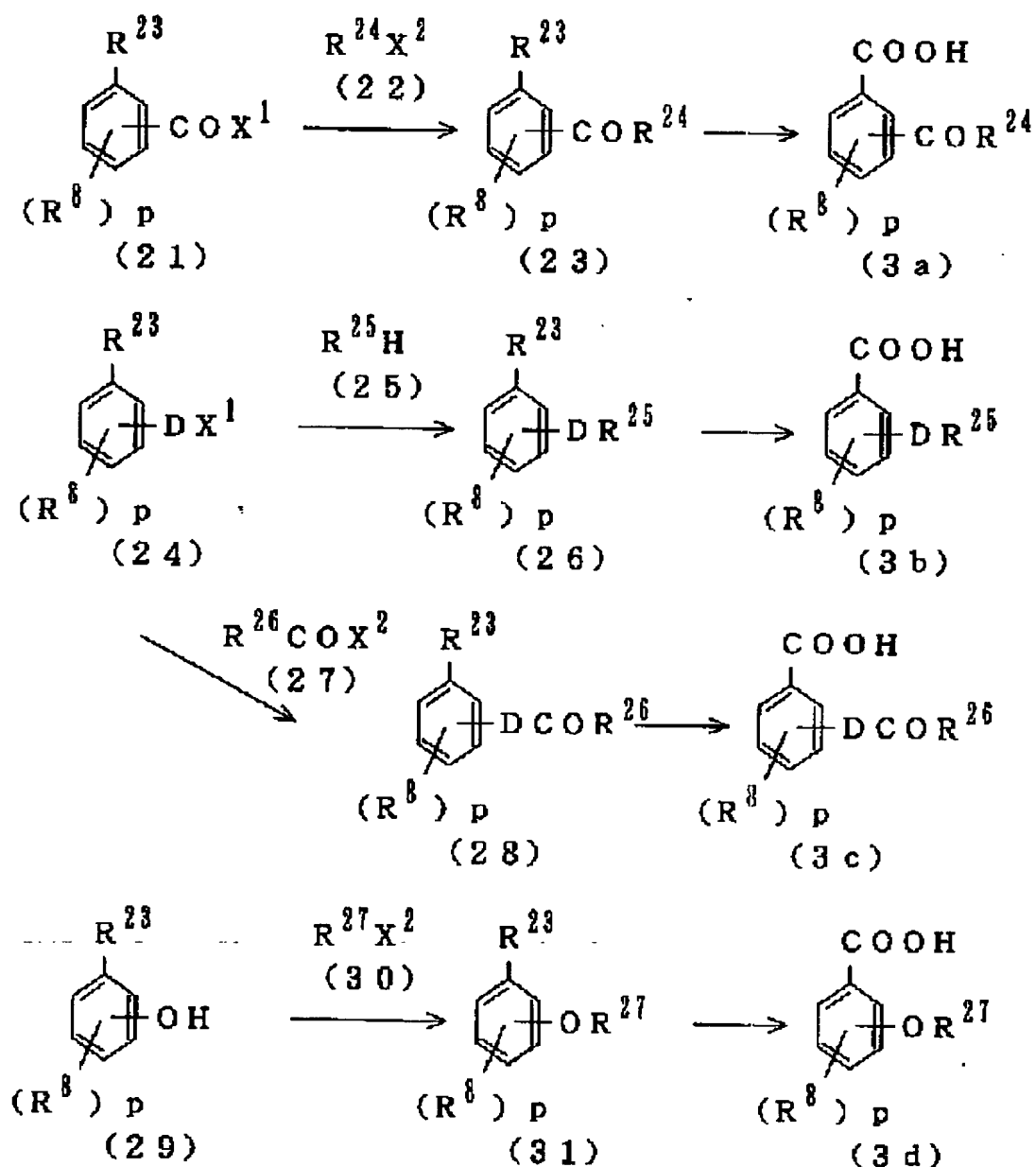
To be produced by for example below-mentioned reaction scheme it is possible the(3) of starting material.

【0336】

【化 53】

[Chemical Formula 53]

反応式- 1 1



【0337】

[式中 p 、 R^8 、 D 及び X^1 は前記に同じ。 R^{24} はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有す]

【0337】

{As for p , $R^{sup>8</sup>}$, D and $X^{sup>1</sup>}$ in Formula same to description above. $R^{sup>24</sup>}$ shows

ることのあるフェニル低級アルキル基を示す。 X^{2} はハロゲン原子を示す。 R^{23} は低級アルコキシカルボニル基を示す。 R^{25} は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ基を示す。 R^{26} は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基を示す。 R^{27} は、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基、又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルキル基を示す。]

化合物(21)と化合物(22)との反応及び化合物(24)と化合物(27)との反応は、適当な溶媒中、亜鉛及び触媒の共存下に行なわれる。

ここで使用される溶媒としては、1,2-ジメトキシエタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

触媒としては、例えばテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム $[Pd(PPh_3)_4]$ 、酢酸パラジウム $[Pd(OCOCH_3)_2]$ 、塩化パラジウム $[PdCl_2]$ 、ビストリフェニルホスフィンニッケルジクロリド $[Ni(PPH_3)_2Cl_2]$ 等の様々なパラジウム化合物やニッケル化合物を例示できる。

該反応は、通常 0~70 deg C、好ましくは 0~50 deg C 付近にて行なわれ、一般に 1~80 時間程度にて終了する。

[0338]

化合物(24)又は化合物(27)の使用量は、化合物(21)又は化合物(22)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル~2 倍モル量程度とするのがよい。

触媒の使用量としては、通常 0.01 倍~等モル程度、好ましくは 0.03~0.3 倍モル量程度とするのがよい。

[0339]

化合物(24)と化合物(25)との反応及び化合物(29)と化合物(30)との反応は、前記反応式-2 にお

phenyl lower alkyl group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent on phenyl ring .

X^{2} shows halogen atom . R^{23} shows lower alkoxy carbonyl group . R^{25} shows phenoxy group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent on phenyl ring . R^{26} shows phenyl group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent on phenyl ring . As for R^{27} , On phenyl ring as substituent as halogen atom , lower alkoxy carbonyl group and substituent group which becomes amino substituted lower alkyl group which has times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group and substituent group which becomes amino carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen phenyl lower alkyl group , which has times when it possesses group which is chosen or benzoyl lower alkyl group which has fact that it possesses halogen atom as substituent is shown on phenyl ring . }

compound (21) with compound (22) with reaction and compound (24) with the compound (27) with reaction, in suitable solvent , is done under coexisting of the zinc and catalyst .

You can list 1 and 2 -dimethoxyethane , diethyl ether , tetrahydrofuran , dioxane or other ethers , acetonitrile , dimethylformamide etc as solvent which is used here.

As catalyst , for example tetrakis triphenyl phosphine palladium $\{Pd(PPh_3)_4\}$, palladium acetate $\{Pd(OCOCH_3)_2\}$, palladium chloride $\{PdCl_2\}$, bis triphenyl phosphine nickel dichloride $\{Ni(PPh_3)_2Cl_2\}$ or other various palladium compound and nickel compound can be illustrated.

said reaction is done with usually 0 - 70 deg C, preferably 0~50deg C vicinity , ends generally at 1- 80 hour extent.

[0338]

compound (24) or as for amount used of compound (27), it is good to make equimole , preferably equimole ~2-fold molar amount extent usually at least, compound (21) or vis-a-vis compound (22).

As amount used of catalyst , it is good usually to make 0.01 times -equimole extent and preferably 0.03~0.3 times molar amount extent.

[0339]

compound (24) with compound (25) with reaction and compound (29) with the compound (30) with as for reaction,

ける化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0340】

化合物(23)、(26)、(28)又は(31)をそれぞれ化合物(3a)、(3b)、(3c)又は(3d)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0341】

【化 54】

反応式-12

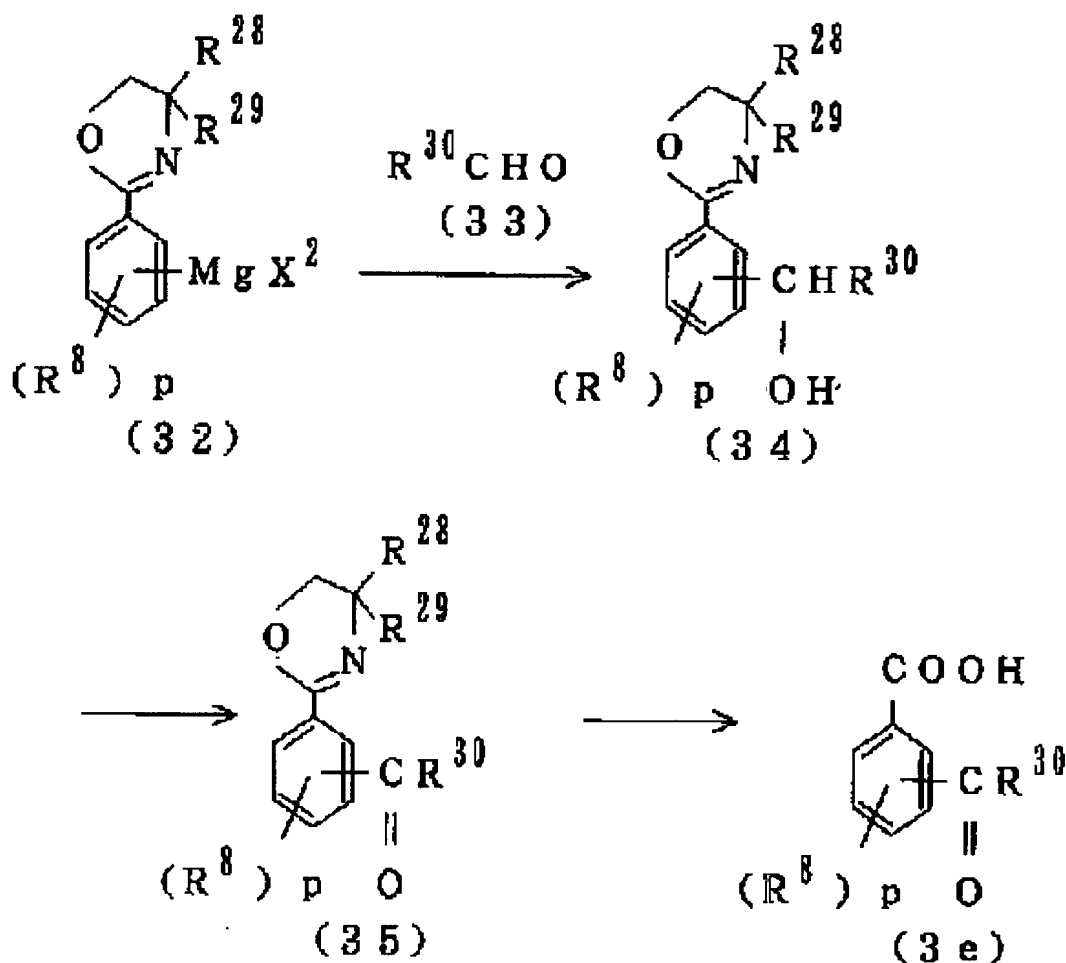
compound in aforementioned reaction scheme -2 (4) with it is possible to be done under condition which is similar to reaction of compound (6 a).

[0340]

compound (23), (26), (28) or (31) respective compound (3 a), (3 b), (3 c) or asfor reaction which is led to (3 d), it is possible to be done under condition which is similar to reaction which leads compound (1 o) in aforementioned reaction scheme -7 to compound (1 p).

[0341]

[Chemical Formula 54]



【0342】

[式で R^{28} 及び R^{29} は、それぞれ低級アルキル基を示す。 R^{30} はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基を示す。p、 R^8 及び X^2 は前記に同じ。]

化合物(32)と化合物(33)との反応は、適当な溶媒中で行なわれる。

ここで使用される溶媒としては、グリニヤール反応で使用される溶媒ならいずれも使用可能であるが、例えばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の飽和炭化水素類等を好ましく例示できる。

化合物(33)の使用量としては、化合物(32)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル~2倍モル量とするのがよい。

上記反応は通常 -70~50 deg C、好ましくは -30 deg C~室温付近にて行なわれ、一般に 1~50 時間程度で終了する。

【0343】

化合物(34)を化合物(35)に導く反応は、適当な溶媒中、酸化剤の存在下に行なわれる。

ここで使用される酸化剤としては、ピリジニウムクロクロメイト、ピリジニウムジクロクロメイト等のクロム酸ピリジニウム塩、ジメチルスルホキシド-オキザリルクロリド、重クロム酸、重クロム酸ナトリウム、重クロム酸カリウム等の重クロム酸塩、過マンガン酸、過マンガン酸カリウム、過マンガン酸ナトリウム等の過マンガン酸塩、二酸化マンガ、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-1,4-ベンゾキノ(DDQ)等を例示できる。

また使用される溶媒としては、例えば、水、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、メタノール、エタノール等のアルコール類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド又はこれらの混合溶媒を例示できる。

酸化剤は、通常出発原料に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル~25 倍モル量使用するのがよい。

反応は、通常 0~100 deg C 程度、好ましくは 0~70 deg C 程度にて行なわれ、一般に 1~7 時間

【0342】

{ R^{28} and R^{29} in Formula show lower alkyl group respectively. R^{30} shows phenyl group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent on phenyl ring. As for p, R^8 and X^2 same to description above. }

compound (32) with compound (33) with reaction is done in suitable solvent .

Also solvent habit gap which is used with Grignard reaction as solvent which is used here, is usable , but for example diethyl ether , dioxane , tetrahydrofuran or other ethers , benzene , toluene or other aromatic hydrocarbons , pentane , hexane , heptane , cyclohexane or other saturated hydrocarbon etc can be illustrateddesirably.

As amount used of compound (33), it is good to make equimole , preferably equimole ~2-fold molar amount usually atleast, vis-a-vis compound (32).

Above-mentioned reaction with usually - is done 70 - 50 deg C, preferably -30deg C~room temperature vicinity , endsgenerally at 1 - 50 hours extent.

【0343】

Reaction which leads compound (34) to compound (35), is done in the suitable solvent and under existing of oxidant .

[pirijiniumukurorokuromeito]
[pirijiniumujikurorokuromeito] or other chromic acid pyridinium salt , dimethyl sulfoxide -oxalyl chloride , dichromic acid , sodium dichromate , potassium dichromate or other dichromate , permanganic acid , potassium permanganate , sodium permanganate or other permanganic acid salt , manganese dioxide , 2, 3- dichloro -5, 6- [jishiano] - 1 and 4 -benzoquinone (DDQ) etc can be illustrated hereas oxidizer that can be used .

In addition for example water, formic acid , acetic acid , trifluoroacetic acid or other organic acid , methanol , ethanol or other alcohols , chloroform , dichloromethane or other halogenated hydrocarbons , tetrahydrofuran , diethyl ether , dioxane or other ethers , dimethyl sulfoxide , dimethylformamide or these mixed solvent can beillustrated as solvent which is used.

As for oxidant , it is good equimole , preferably equimole ~25-times molar amount to use at least usuallyvis-a-vis starting material .

Reaction, is done at usually 0 - 100 deg C extent, and preferably 0~70deg C extentends generally at 1 - 7 hours

程度にて終了する。

【0344】

化合物(35)を化合物(3e)に導く反応は、適当な溶媒中、アルキル化剤の存在下に化合物(35)をアルキル化した後、得られる化合物を加水分解するか、又は化合物(35)を直接加水分解することにより行なわれる。

【0345】

化合物(35)をアルキル化するに当り、使用されるアルキル化剤としては、沃化メチル等のハロゲン化アルキル等を例示できる。

アルキル化は、通常室温~200 deg C、好ましくは室温~150 deg Cにて行なわれ、一般に1~30時間程度にて終了する。

使用される溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド、アセトン、アセトニトリル、ニトロメタン等の極性溶媒を例示できる。

アルキル化剤は、化合物(35)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル~8倍モル量使用するのがよい。

【0346】

引続き行なわれる加水分解反応には、通常の加水分解の反応条件をいずれも適用でき、具体的には例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウム等の塩基性化合物又は塩酸、硫酸等の鉱酸、酢酸等の有機酸等の存在下、水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸等の溶媒又はそれらの混合溶媒中にて行なわれる。

該反応は、通常室温~200 deg C、好ましくは室温~150 deg C付近にて進行し、一般に0.5~20時間程度にて終了する。

【0347】

化合物(35)を直接加水分解する反応も、上記加水分解条件と同様の条件下に行ない得る。

extent.

【0344】

Reaction which leads compound (35) to compound (3 e) after alkylation doing compound (35) in suitable solvent and under existing of alkylation agent , the hydrolysis does compound which is acquired, or is done by hydrolysis doing compound (35) directly.

【0345】

When compound (35) is done alkylation , methyl iodide or other alkyl halide etc can be illustrated as alkylation agent which is used.

alkylation is done usually with room temperature ~200deg C, preferably room temperature ~150deg C, ends generally at 1 - 30hour extent.

for example dioxane , tetrahydrofuran , ethyleneglycol dimethyl ether , diethyl ether or other ethers , benzene , toluene , xylene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , carbon tetrachloride or other halogenated hydrocarbons , methanol , ethanol , isopropanol or other lower alcohols , dimethylformamide , dimethyl sulfoxide , hexamethyl phosphoric acid triamide , acetone , acetonitrile , nitromethane or other polar solvent can be illustrated as solvent which is used.

As for alkylation agent , it is good equimolar amount , preferably equimole ~8 times molar amount to use usually at least vis-a-vis compound (35).

【0346】

In each case be able to apply reaction condition of conventional hydrolysis to hydrolysis reaction which is done continuously, concretely under for example sodium carbonate , potassium carbonate , lithium hydroxide , sodium hydroxide , potassium hydroxide , barium hydroxide or other basic compound or hydrochloric acid , sulfuric acid or other mineral acid , acetic acid or other organic acid or other existing, water and methanol , ethanol , isopropyl alcohol or other alcohols , acetone , methylethyl ketone or other ketones , dioxane , ethyleneglycol dimethyl ether or other ethers , acetic acid or other solvent or it is done in mixed solvent of those.

It advances said reaction, usually with room temperature ~200deg C, preferably room temperature ~150deg C vicinity , ends generally at 0.5 - 20 hour extent.

【0347】

It can do also reaction which hydrolysis does compound (35) directly, under condition which is similar to

水分解条件と同様の条件下に行ない得る。

この場合の反応時間は 1~30 時間程度とするのがよい。

【0348】

また化合物(35)を硫酸、塩酸、硝酸等の鉱酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等の存在下、上記加水分解と同様の溶媒、反応温度、反応時間にて加水分解することによっても化合物(3e)を得ることができる。

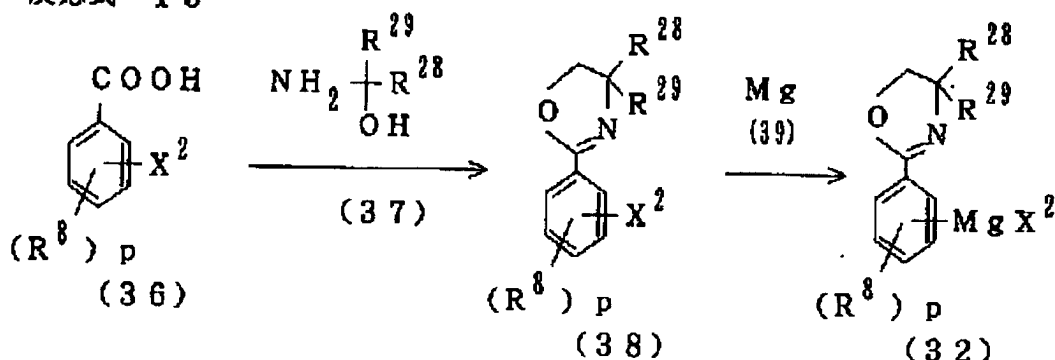
【0349】

出発原料の化合物(32)は例えば下記反応式-13に示す方法で製造されることができる。

【0350】

【化 55】

反応式-13



【0351】

【式中 p、R⁸、R²⁸、R²⁹ 及び X² は前記に同じ。】

化合物(36)と化合物(37)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応のうちカルボン酸ハライドを用いる方法と同様の条件下に行なわれることができる。

化合物(37)の使用量としては化合物(36)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル~2倍モル量とするのがよい。

【0352】

化合物(38)を化合物(39)との反応は、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサ

above-mentioned hydrolysis condition .

As for reaction time in this case it is good to make 1 - 30 hour extent.

【0348】

In addition compound (35) under sulfuric acid , hydrochloric acid , nitric acid or other mineral acid , acetic acid , aromatic sulfonic acid or other organic acid or other existing, with solvent , reaction temperature , reaction time which issimilar to above-mentioned hydrolysis compound (3 e) can be acquired evenby fact that hydrolysis it does.

【0349】

To be produced with method which is shown in for example below-mentioned reaction scheme -13 it is possible compound (32) of starting material .

【0350】

【Chemical Formula 55】

【0351】

{As for p, R⁸, R²⁸, R²⁹ and X² in Formula same to description above. }

compound (36) with compound (37) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -1 (2) with compound (3) with it is possible to bedone under condition which is similar to method which uses theinside carboxylic acid halide of reaction.

As amount used of compound (37) it is good to make equimole , preferably equimole ~2-fold molar amount at least, vis-a-vis compound (36).

【0352】

compound (39) with as for reaction, in solvent , with usually such as for example diethyl ether , tetrahydrofuran , dioxane ,

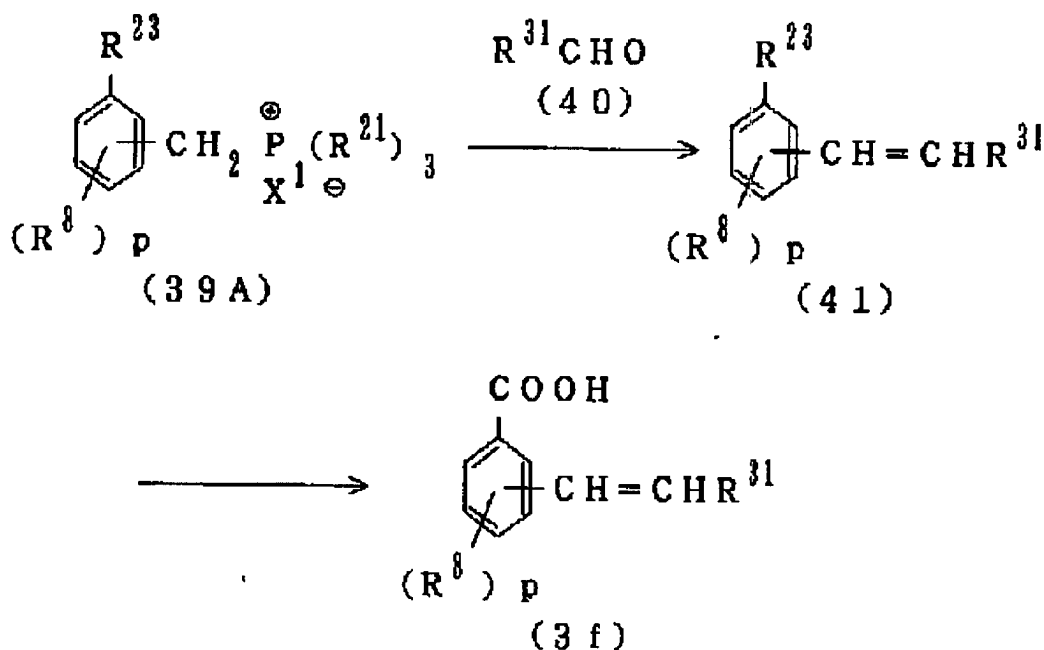
ン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、n-ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類等溶媒中、通常 0~150 deg C、好ましくは 0~100 deg C 付近にて、0.5~5 時間程度反応させることにより行なうことができる。

化合物(39)の使用量は化合物(38)に対して、少なくとも等モル、好ましくは等モル~1.5 倍モル量程度とするのがよい。

【0353】

【化 56】

反応式 - 1 4



【0354】

〔式中 p、R⁸、R²³、R²¹ 及び X¹ は前記に同じ。R³¹ はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。〕

化合物(39A)と化合物(40)との反応は、前記反応式-6 における化合物(1e)と化合物(14)又は(15)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0354】

{As for p, R⁸, R²³, R²¹ and X¹ in Formula same to description above. R³¹ shows phenyl group which has fact that it possesses the halogen atom on phenyl ring. }

compound (39 A) with compound (40) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -6 (1 e) with compound (14) or it is possible to be done under condition which is similar to reaction of (15).

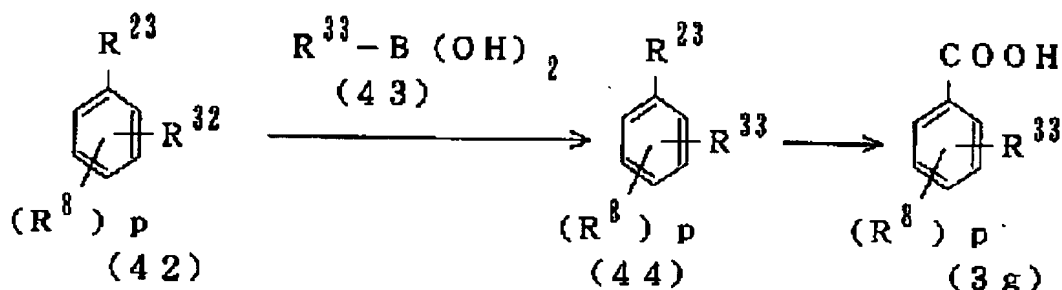
【0355】

化合物(41)を化合物(3f)に導く反応は、前記反応式-6における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0356】

【化 57】

反応式 - 15



【0357】

【式中p、 R^8 及び R^{23} は前記に同じ。 R^{32} はハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニルオキシ基又はハロゲン原子を示す。 R^{33} は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基を示す。】

化合物(42)と化合物(43)との反応は、適当な溶媒中、リチウムクロリド等のリチウム化合物の存在下又は不存在下、塩基性化合物及び触媒の存在下で行なわれる。

ここで使用される溶媒としては、前記反応式-13における化合物(38)と化合物(39)との反応で例示された溶媒をいずれも使用することができる。

塩基性化合物としては、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)の反応のうちカルボン酸ハライドを用いる方法で例示された塩基性化合物をいずれも使用することができる。

触媒としては、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、塩化パラジウム等のパラジウム化

【0355】

As for reaction which leads compound (41) to compound (3 f), it is possible to be done under condition which is similar to reaction which leads compound (1 o) in aforementioned reaction scheme -6 to compound (1 p).

【0356】

[Chemical Formula 57]

【0357】

{As for p, $R^{8\text{sup}}$ and $R^{23\text{sup}}$ in Formula same to description above. $R^{32\text{sup}}$ shows lower alkyl sulfonyloxy group or halogen atom which has times when it possesses halogen atom. $R^{33\text{sup}}$ on phenyl ring as substituent shows phenyl group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes amino substitution lower alkoxy group which has times when it possesses lower alkyl group as amino group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, halogen atom substitution lower alkoxy group, phenyl group and substituent which have times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group, lower alkoxy group, phenyl lower alkoxy group, nitro group, substituent. }

compound (42) with compound (43) with reaction, in suitable solvent, under existing of lithium chloride or other lithium compound or under absence, is done under existing of basic compound and catalyst.

compound in aforementioned reaction scheme -13 as solvent which is used here, (38) with compound (39) with solvent which was illustrated with reaction can be used in each case.

As basic compound, compound in aforementioned reaction scheme -1 (2) with basic compound which was illustrated with method which uses inside carboxylic acid halide of reaction of compound (3) can be used in each case.

As catalyst, tetrakis (triphenyl phosphine) palladium, palladium chloride or other palladium compound can be

JP1997221476A

1997-8-26

合物を挙げることができる。

該反応は、通常室温~200 deg C、好ましくは室温~150 deg C 付近にて行なわれ、一般に1~10時間程度にて終了する。

塩基性化合物及びリチウム化合物は、化合物(42)に対して、少なくとも等モル、好ましくは等モル~2倍モル量使用するのがよい。

また触媒は、触媒量使用するのがよい。

【0358】

化合物(44)を化合物(3g)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0359】

【化 58】

listed.

said reaction is done usually with room temperature ~200deg C, preferably room temperature ~150deg C vicinity, ends generally at 1 -10 hours extent.

As for basic compound and lithium compound, it is good equimole, preferably equimole ~2-fold molar amount to use at least vis-a-vis compound (42).

In addition as for catalyst, catalyst amount it is good to use.

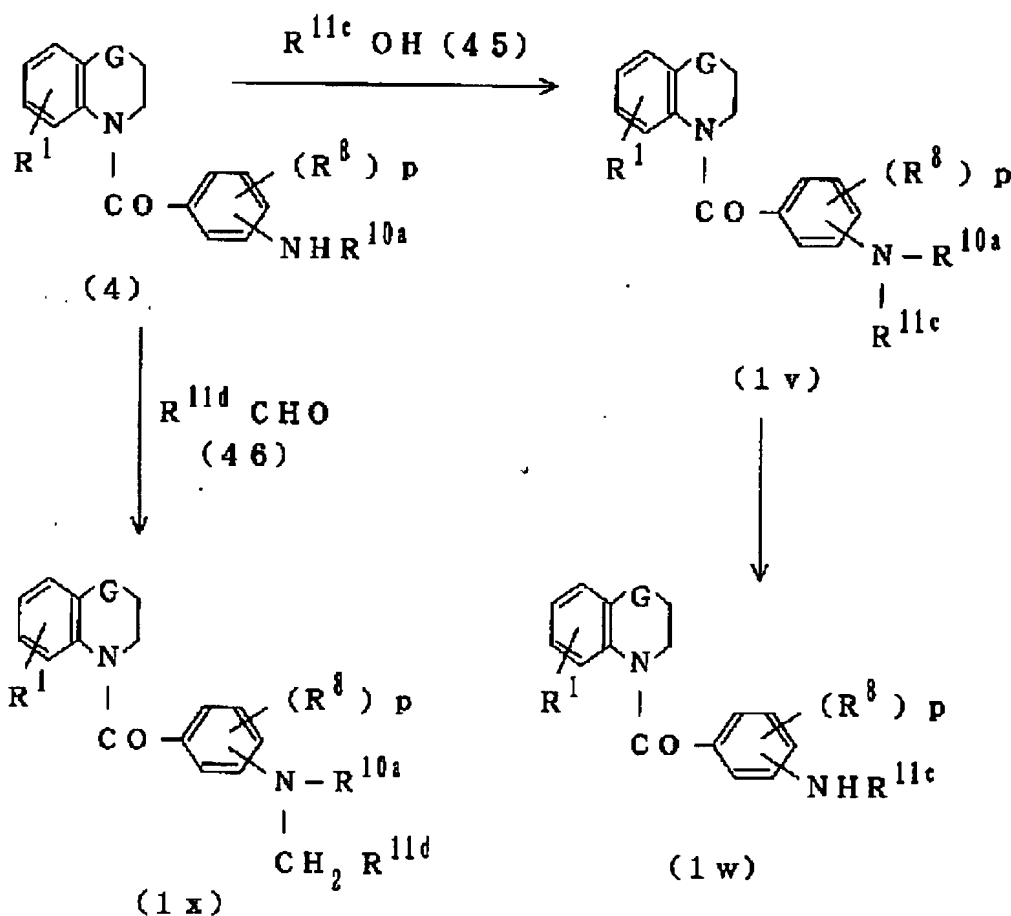
[0358]

As for reaction which leads compound (44) to compound (3 g), it is possible to be done under condition which is similar to reaction which leads compound (1 o) in aforementioned reaction scheme -7 to compound (1 p).

[0359]

[Chemical Formula 58]

反応式-16



【0360】

〔式中 G、p、 R^1 、 R^8 及び R^{10a} は前記に同じ。 R^{11c} は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、ベンゾイル低級アルキル基、又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基を示す。 R^{11d} は、前記 R^{11c} に加えて、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基を示す。〕

化合物(4)と化合物(45)との反応は、例えばジエ

【0360】

{As for G, p, R^{11c} and R^{10a} in Formula same to description above. phenoxyl lower alkyl group which has fact that it possesses lower alkyl group as substituent is shown on phenyl lower alkyl group, benzoyl lower alkyl group, or phenyl ring where R^{11c} on phenyl ring are times when it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkyl group and halogen atom, as substituent has times when at same time it possesses hydroxy group in lower alkyl group portion. R^{11d} on phenyl ring shows phenyl group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes the lower alkyl group and halogen atom as substituent in addition to aforementioned R^{11c} . }

compound (4) with compound (45) with reaction is produced

チルアゾジカルボキシレート、ジブチルアゾジカルボキシレート等のジアルキルアゾジカルボキシレート類、1,1'-アゾジカルボニルジ(ピペリジン)等のジアルキルアゾジカルボキシアミド類及びトリアルキルホスフィン、トリアリールホスフィン等のリン酸化合物の存在下に反応させることにより製造される。

使用される溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

ジアルキルアゾジカルボキシレート類、リン酸化合物及び化合物(45)は、化合物(4)に対してそれぞれ少なくとも等モル程度、好ましくは 1~3 倍モル程度用いるのがよい。

該反応は、通常 -20~100 deg C、好ましくは -20~50 deg C にて進行し、一般に 1~30 時間で反応は終了する。

【0361】

R^{10a} が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す化合物(1v)の場合、該化合物を加水分解することにより、対応する化合物(1w)に導くことができる。

この反応は、後記一般式(1)において R⁹ がフェニル環上に低級アルカノイルオキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物の加水分解反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0362】

化合物(4)と化合物(46)との反応は、前記反応式-3 における化合物(1e)を(1g)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

化合物(46)の使用量は、化合物(4)に対して少なくとも等モル、好ましくは 1~3 倍モル量とするのがよい。

【0363】

【化 59】

for example diethyl azo dicarboxylate, dibutyl azo dicarboxylate or other dialkyl azo dicarboxylate, by 1 and 1'-azo di carbonyl di (piperidine) or other dialkyl azo dicarboxy amides and reacting under existing of trialkyl phosphine, triaryl phosphine or other phosphate.

for example tetrahydrofuran, 1, 2- dimethoxyethane, diethyl ether, diisopropyl ether, diglyme or other ethers, benzene, toluene or other aromatic hydrocarbons or you can list these mixed solvent etc as solvent which is used.

It is good vis-a-vis compound (4) dialkyl azo dicarboxylate, as for phosphate and the compound (45), each one at least equimole extent and preferably 1~3 times mole extent to use.

With usually - it advances said reaction, 20 - 100 deg C, preferably -20~50deg C, reaction ends generally in 1 - 30 hours.

【0361】

When R^{10a} it is a compound (1 v) which shows lower alkanoyl group which has the fact that it possesses halogen atom as substituent, it is possible to lead to compound (1 w) which corresponds by hydrolysis doing said compound.

To be done under condition which is similar to hydrolysis reaction of compound which shows phenyl group where R⁹ at least one has lower alkanoyl oxy group on the phenyl ring in postscript General Formula (1) it is possible this reaction.

【0362】

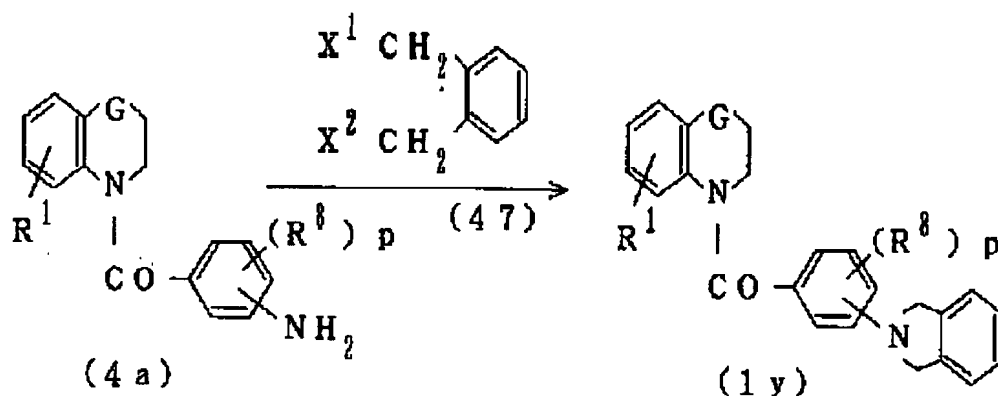
compound (4) with compound (46) with as for reaction, it is possible to be done under condition which is similar to reaction which leads compound (1 e) in aforementioned reaction scheme -3 to (1 g).

As for amount used of compound (46), it is good to make equimole, preferably 1~3 times molar amount atleast, vis-a-vis compound (4).

【0363】

[Chemical Formula 59]

反応式- 17



【0364】

〔式中 G、p、R¹、R⁸、X¹ 及び X² は前記に同じ。〕

化合物(4a)と化合物(47)の反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0364】

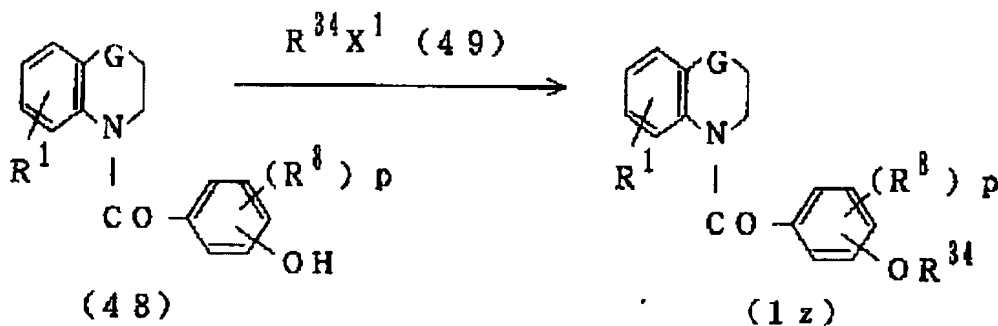
{As for G, p, R¹, R⁸, X¹ and X² in Formula same to description above. }

compound (4 a) with as for reaction of compound (47), compound in theaforementioned reaction scheme -2 (4) with it is possible to be done under condition which is similar to reaction of compound (6 a).

【0365】

【化 60】

反応式- 18



【0366】

〔式中 G、p、R¹、R⁸ 及び X¹ は前記に同じ。R³⁴ は、低級アルキル基、低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を

【0366】

{As for G, p, R¹, R⁸ and X¹ in Formula same to description above. R³⁴ on lower alkyl group, lower alkanoyl group, phenyl ring as substituent as halogen atom, lower alkoxy carbonyl group and substituent from group which

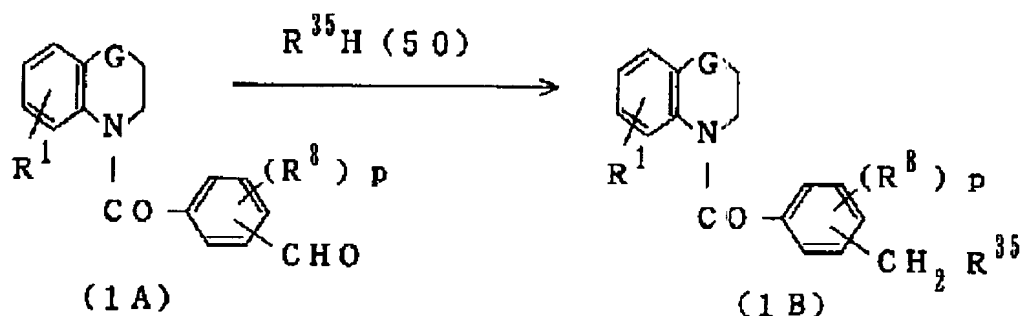
有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基、又はピロリジニル置換低級アルキル基を示す。]

化合物(48)と化合物(49)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0367】

【化 61】

反応式-19



【0368】

【式中 G、p、R¹ 及び R⁸ は前記に同じ。R³⁵ はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ基を示す。】

化合物(1A)と化合物(50)との反応は、前記反応式-3 における化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

化合物(50)の使用量は、化合物(1A)に対して、少なくとも等モル量、好ましくは等モル~5 倍モル量とするのがよい。

【0369】

【化 62】

becomes amino substituted lower alkyl group which has times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group and substituent shows phenyl lower alkyl group, or the pyrrolidinyl substituted lower alkyl group which has times when it possesses group which is chosen from group which becomes amino carbonyl group which has times when it possesses group which is chosen. }

compound (48) with compound (49) with as for reaction, compound in the aforementioned reaction scheme -2 (4) with it is possible to be done under condition which is similar to reaction of compound (6 a).

【0367】

[Chemical Formula 61]

【0368】

{As for G, p, R¹ and R⁸ in Formula same to description above. R³⁵ shows anilino group which has fact that it possesses the lower alkyl group as substituent on phenyl ring . }

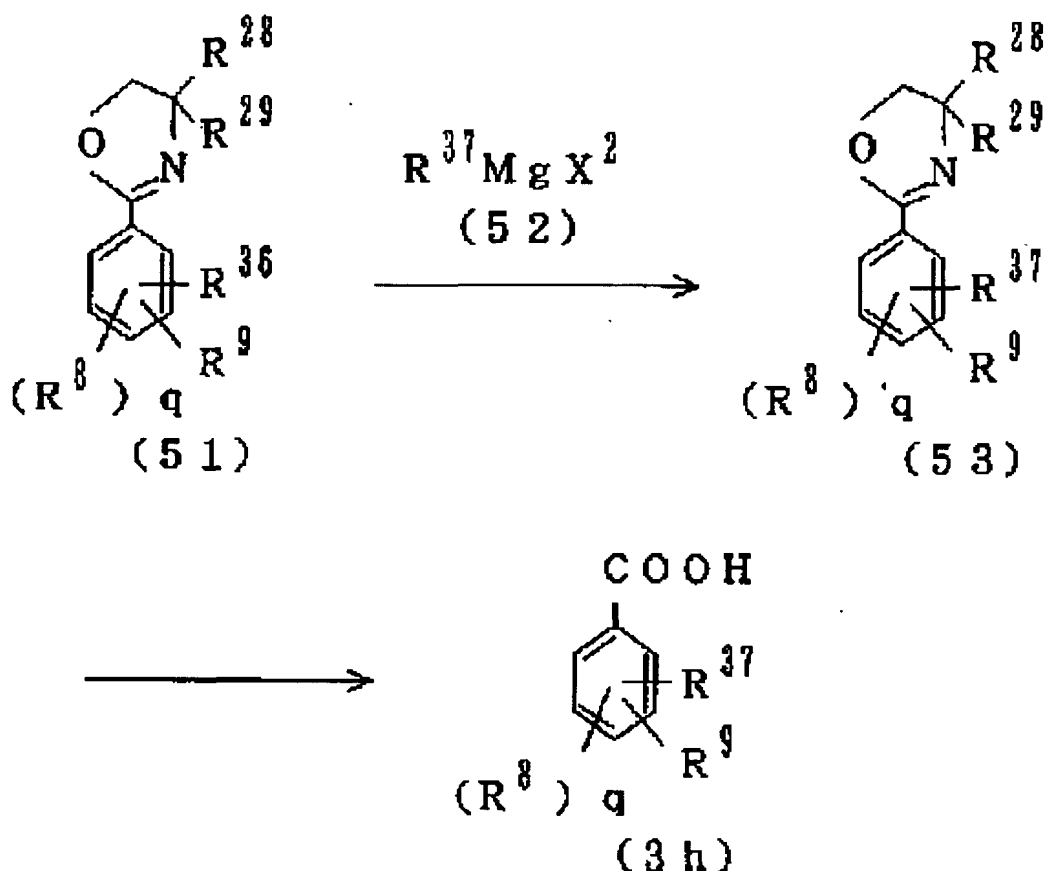
compound (1 A) with compound (50) with as for reaction, it is possible to be done under condition which is similar to reaction which leads compound (1 e) in aforementioned reaction scheme -3 to compound (1 g).

As for amount used of compound (50), it is good to make equimolar amount, preferably equimole ~5 times molar amount atleast, vis-a-vis compound (1 A).

【0369】

[Chemical Formula 62]

反応式 - 20



【0370】

〔式中 R^{36} は低級アルコキシ基又はハロゲン原子を示す。 R^{37} は低級アルキル基を示す。 R^8 、 R^{28} 、 R^{29} 、 R^9 及び X^2 は前記に同じ。 q は 0 又は 1 を示す。〕

化合物(51)と化合物(52)との反応は、前記反応式-12 における化合物(32)と化合物(33)の反応と同様の条件下にて行なわれる。

化合物(52)の使用量は化合物(51)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル~2 倍モル量とするのがよい。

【0371】

[0370]

{ R^{36} in Formula shows lower alkoxy group or halogen atom . R^{37} shows lower alkyl group . As for R^8 , R^{28} , R^{29} , R^9 and X^2 same to description above. q shows 0 or 1 . }

compound (51) with compound (52) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -12 (32) with it is done under condition which issimilar to reaction of compound (33).

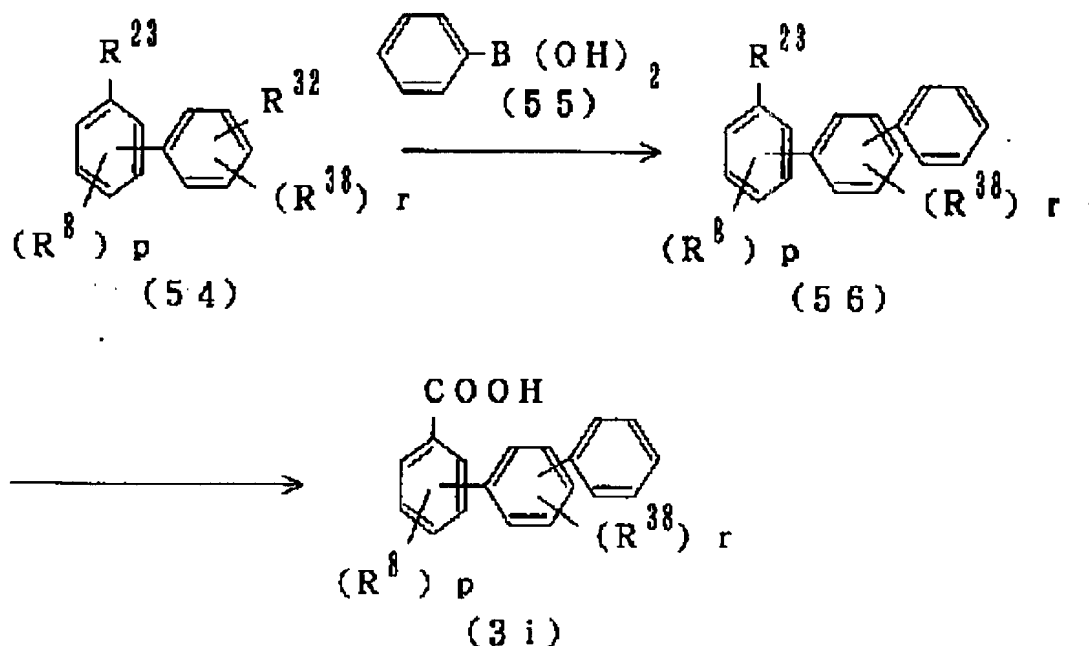
As for amount used of compound (52) it is good to make equimole , preferably equimole ~2-fold molar amount atleast, vis-a-vis compound (51).

[0371]

【化 63】

[Chemical Formula 63]

反応式- 2 1



【0372】

〔式中 R^8 、 p 、 R^{32} 及び R^{23} は前記に同じ。 R^{38} は、低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基を示す。 r は 0、1 又は 2 を示す。〕

化合物(54)と化合物(55)との反応は、前記反応式-15 における化合物(42)と化合物(43)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0373】

化合物(56)を化合物(3i)に導く反応も、前記反応式-15 の化合物(44)を化合物(3g)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0374】

【0372】

{As for R^{38} , p , R^{32} and R^{23} in Formula same to description above. R^{38} shows amino substitution lower alkoxy group which has fact that it possesses lower alkyl group as amino group, phenyl group or substituent which has times when it possesses lower alkanoyl group as lower alkyl group, lower alkoxy group, phenyl lower alkoxy group, hydroxy group, lower alkanoyl oxy group, halogen atom substitution lower alkoxy group, nitro group, substituent. r shows 0, 1 or 2. }

compound (54) with compound (55) with as for reaction, compound in the aforementioned reaction scheme -15 (42) with it is done under condition which is similar to reaction of compound (43).

【0373】

Also reaction which leads compound (56) to compound (3i), is done under condition which is similar to reaction which leads compound (44) of aforementioned reaction scheme -15 to compound (3g).

【0374】

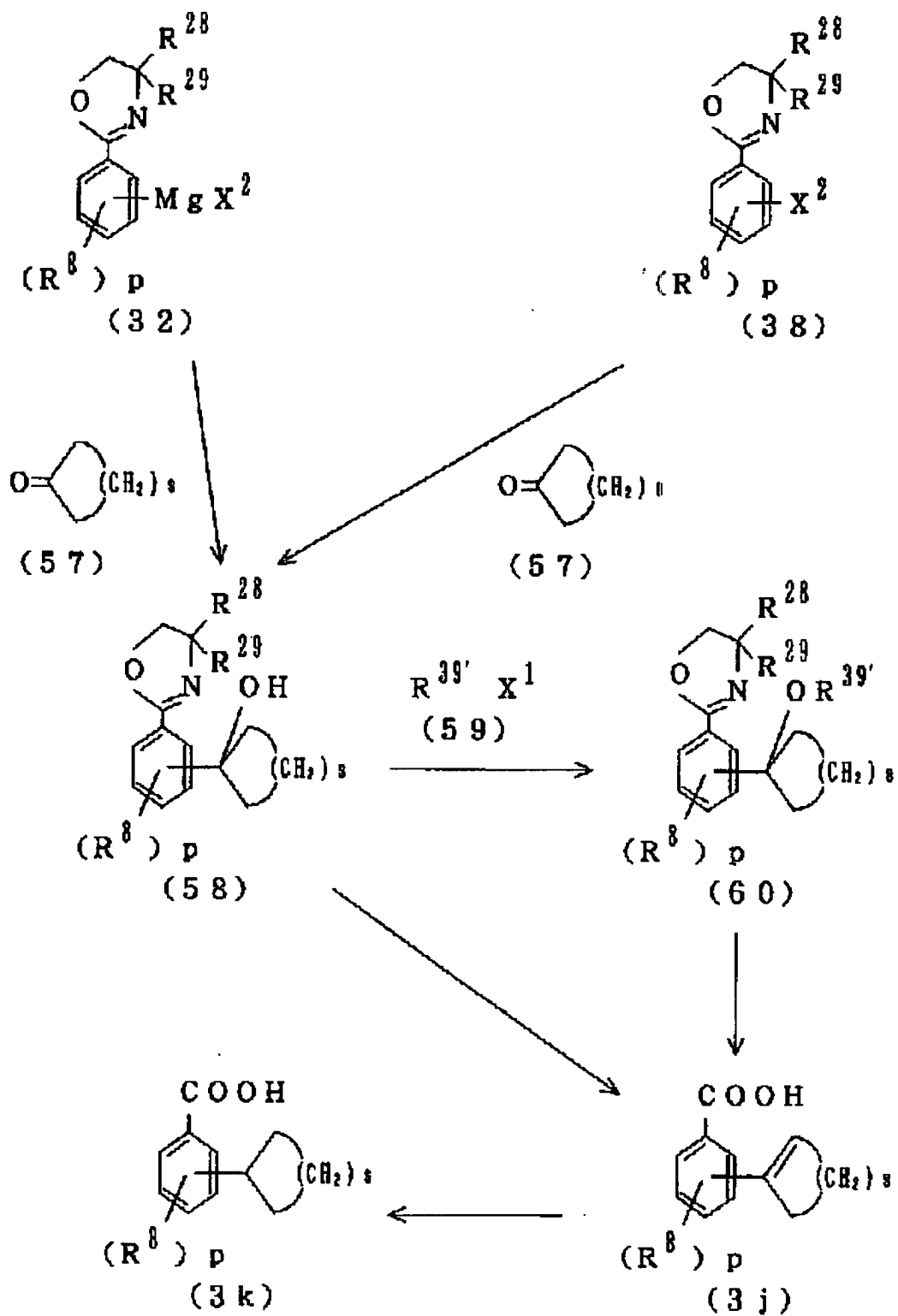
JP1997221476A

1997-8-26

【化 64】

[Chemical Formula 64]

反応式- 2 2



【0375】

【式】 R^{28} , R^{29} , R^8 , p , X^1 及び X^2 は前記に同じ。 s は 0~5 の整数を示す。 $R^{39'}$ は低級アルキル基を示す。】

化合物(32)と化合物(57)との反応は、前記反応式-12 における化合物(32)と化合物(33)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0376】

化合物(58)と化合物(59)との反応は、前記反応式-2 における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0377】

化合物(38)と化合物(57)との反応は、前記反応式-6 における化合物(1e)と化合物(14)又は化合物(15)との反応と同様の条件下に行なわれる。

化合物(57)の使用量は、化合物(38)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル~1.5 倍モル量とするのがよい。

【0378】

化合物(58)又は化合物(60)を化合物(3j)に導く反応は、反応時間が一般に 1~50 時間程度で終了する他は、前記反応式-7 における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0379】

化合物(3j)を化合物(3k)に導く反応は、前記反応式-3 における化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応中の接触水素添加する方法と同様の条件下に行なわれる。

【0380】

【化 65】

【0375】

{As for R^{28} , R^{29} , R^8 , p , X^1 and X^2 in Formula same to description above. s shows integer 0 - 5. $R^{39'}$ shows lower alkyl group. }

compound (32) with compound (57) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -12 (32) with it is done under condition which issimilar to reaction of compound (33).

【0376】

compound (58) with compound (59) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -2 (4) with it is done under condition which issimilar to reaction of compound (6 a).

【0377】

compound (38) with compound (57) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -6 (1 e) with compound (14) or compound (15) with it isdone under condition which is similar to reaction.

As for amount used of compound (57), it is good to make equimole , preferably equimole ~1.5 times molar amount atleast, vis-a-vis compound (38).

【0378】

compound (58) or as for reaction which leads compound (60) to the compound (3 j), besides reaction time ends generally at 1 - 50 hours extnt, itis done under condition which is similar to reaction which leads compound (1 o) in aforementioned reaction scheme -7 to compound (1 p).

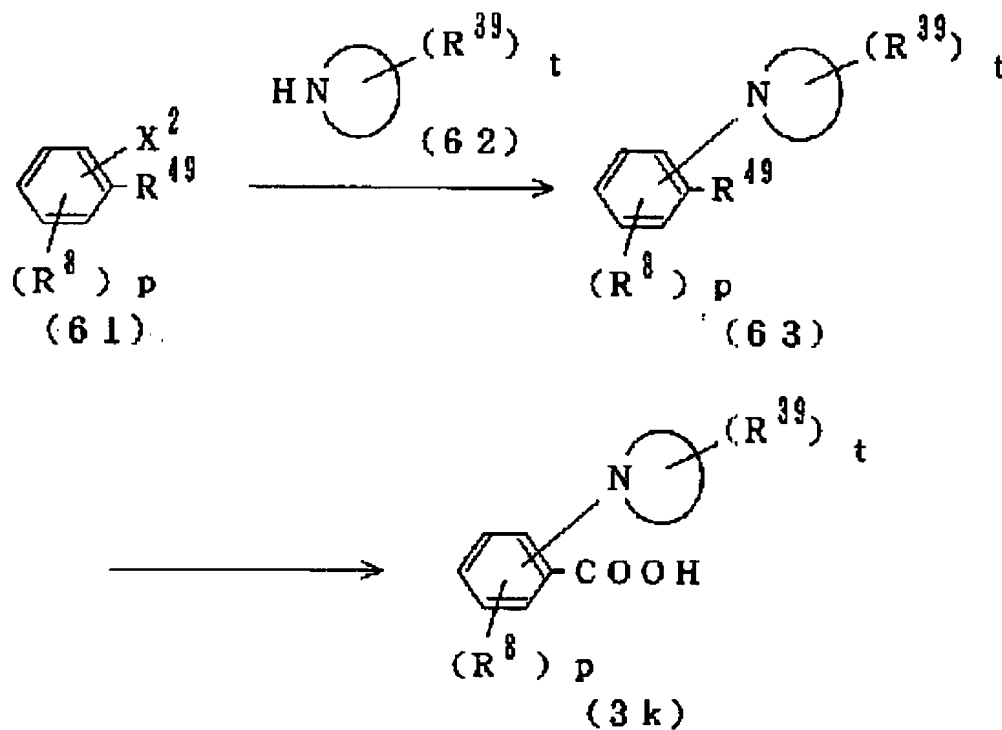
【0379】

As for reaction leading compound (3 j) to compound (3 k), contact hydrogenation which is in midst of reacting which leads compound (1 e) in theaforementioned reaction scheme -3 to compound (1 g) it is done under condition which is similar to method which is done.

【0380】

【Chemical Formula 65】

反応式- 2 3



【0381】

〔式中 R^8 、 p 及び X^2 は前記に同じ。 R^{39} は低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハゲン原子、フェニル低級アルキル基又はオキシ基を示す。 t は 0~3 の整数を示す。 R^{49} はシアノ基、低級アルコキシカルボニル基又はカルボキシル基を示す。基〕

【0382】

【化 66】

[0381]

{As for $R^{8/}$, p and $X^{2/}$ in Formula same to description above. $R^{39/}$ shows lower alkyl group, phenyl group, lower alkanoyl group, halogen atom, phenyl lower alkyl group or oxo group. t shows integer 0 - 3. $R^{49/}$ shows cyano group, lower alkoxy carbonyl group or carboxyl group. Basis}

[0382]

[Chemical Formula 66]



【0383】

は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する飽和又は不飽和の5員~11員環の単環又は二項環の複素環基を示す。

]

化合物(61)と化合物(62)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0384】

R⁴⁹ がシアノ基又は低級アルコキシカルボニル基である化合物(63)の場合、化合物(63)を化合物(3K)に導く反応は、前記反応式-7の化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0385】

【化 67】

[0383]

monocycle of saturated or unsaturated 5-member ~11 member ring which 1 - 4 possesses nitrogen atom , oxygen atom or sulfur atom or heterocyclic group of binary ring is shown.

)

compound (61) with compound (62) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -2 (4) with it is possible to be done under condition which is similar to reaction of compound (6 a).

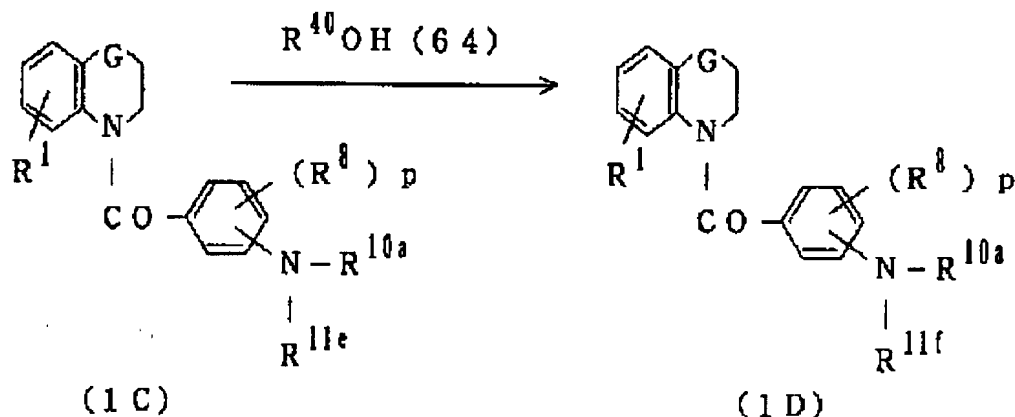
[0384]

When it is a compound (63) where R^{>49} is cyano group or lower alkoxy carbonyl group , thereaction which leads compound (63) to compound (3 K) is done under the condition which is similar to reaction which leads compound (1 o) of theaforementioned reaction scheme -7 to compound (1 p).</sup>

[0385]

[Chemical Formula 67]

反応式- 2 4



[0386]

〔式中 G、R¹、R⁸、p 及び R^{10a} は前記に同じ。R^{11e} は、置換基としてハロゲン原子を有する低級アルカノイル基を示す。R⁴⁰ は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基、ニトロ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基、低級アルキル基、低級アルカノイル基、キノリル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリル基又はテトラヒドロナフチル基を示す。R^{11f} は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基、ニトロ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基又はテトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基を示す。〕

化合物(1C)と化合物(63)との反応は、前記反応式-2 における化合物(4)と化合物(6a)との反応と

[0386]

{As for G, R¹, R⁸, p and R^{10a} in Formula same to description above. R^{11e} shows lower alkanoyl group which possesses halogen atom as substituent. R⁴⁰ on phenyl ring as substituent from group which becomes the amino group, lower alkanoyl group substituted amino group, nitro group and halogen atom which have times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group, phenyl group, lower alkoxy group, halogen atom substituted lower alkyl group, substituent on phenyl group, lower alkyl group, lower alkanoyl group, quinolyl group, quinoline ring which has times when it possesses the group which is chosen shows tetrahydro quinolyl group or tetrahydro naphthyl group which has timeswhen it possesses group which is chosen from group whichbecomes lower alkyl group and oxo group as substituent. As for R^{11f}, On phenyl ring as substituent group which becomes amino group, lower alkanoyl group substituted amino group, nitro group and the halogen atom which have times when it possesses lower alkyl group as lower alkyl group, phenyl group, lower alkoxy group, halogen atom substituted lower alkyl group, substituent on phenoxy lower alkanoyl group, lower alkoxy-substituted lower alkanoyl group, lower alkanoyl oxy substitution lower alkanoyl group, quinolyloxy substitution lower alkanoyl group, quinoline ring which has timeswhen it possesses group which is chosen group which becomes lower alkyl group and oxo group as substituent tetrahydro quinolyloxy substitution lower alkanoyl group which has times when it possesses group which is chosen or tetrahydro naphthyloxy substitution lower alkanoyl group is shown. }

compound (1 C) with compound (63) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -2 (4) with

同様の条件下に行なわれる。

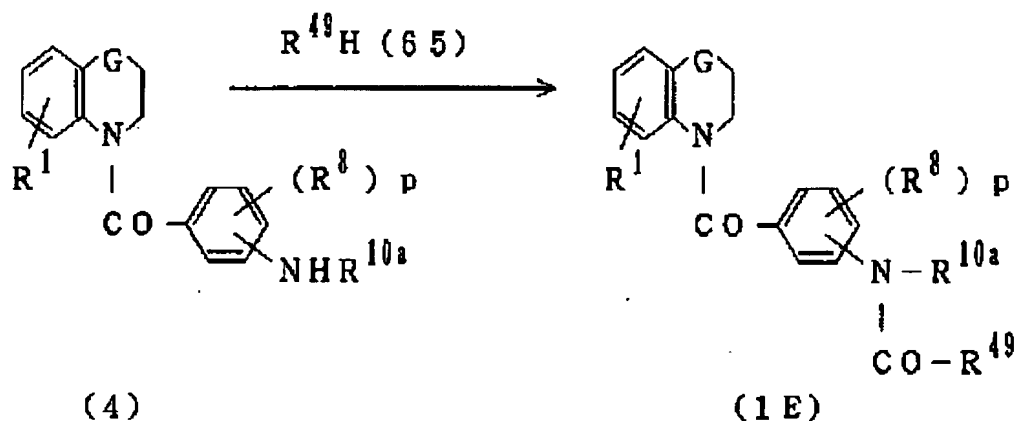
【0387】

R^{11f} が低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基である化合物(1D)を前記反応式-7 における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に反応させて、対応するR^{11f}が置換基として水酸基を有する低級アルカノイル基である化合物(1D)に導くことができる。

【0388】

【化 68】

反応式- 2 5



【0389】

〔式中 R¹、G、R⁸、p 及び R^{10a} は前記に同じ。R⁴⁹ はテトラヒドロイソキノリル基又は基〕

【0390】

【化 69】

compound (6 a) with it is done under the condition which is similar to reaction.

【0387】

Reacting under condition which is similar to reaction which leads compound (1 o) in compound (1 D) where R^{11f} is lower alkanoyl oxy substitution lower alkanoyl group aforementioned reaction scheme -7 to compound (1 p), R^{11f} which corresponds it is possible to lead to compound (1 D) which is a lower alkanoyl group which possesses hydroxy group as substituent .

【0388】

[Chemical Formula 68]

【0389】

{As for R¹, G, R⁸, p and R^{10a} in Formula same to description above. As for R⁴⁹ tetrahydroisoquinolyl group or basis}

【0390】

[Chemical Formula 69]



【0391】

を示す。

]

化合物(4)を化合物(1E)に導く反応は、(1)適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に化合物(4)とカルボニル化剤とを反応させた後、次いで(2)適当な溶媒中、上記で得られる反応生成物を塩基性化合物の存在下化合物(65)と反応させることにより実施される。

【0392】

(1)の反応において、使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応式-1 のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

使用されるカルボニル化剤としては、カルボニルジイミダゾール、ホスゲン、ダイホスゲン、尿素、トリホスゲン等を例示できる。

カルボニル化剤の使用量は、化合物(4)に対して、通常 0.05~等モル、好ましくは 0.1~等モル量とするのがよい。

該反応は、通常 0~200 deg C、好ましくは 0~180 deg C 付近にて、1~10 時間程度にて終了する。

【0391】

It shows.

)

Reaction which leads compound (4) to compound (1 E) is executed the reaction product which compound (4) with carbonylation agent after reacting, next isacquired with in and description above (2) suitable solvent in (1) suitable solvent and under existing of basic compound under existing of basic compound compound (65) with by reacting.

【0392】

solvent and basic compound which are used with method which amine (2) reacts to carboxylic acid halide of aforementioned reaction scheme -1 at time ofreacting of (1), as solvent and basic compound which are used, can beused in each case.

carbonyl diimidazole , phosgene , die phosgene , urea , tri phosgene etc can be illustrated as carbonylation agent which is used.

As for amount used of carbonylation agent , it is good to make usually 0.05 - the equimole , preferably 0.1 ~equimolar amount , vis-a-vis compound (4).

said reaction, with usually 0 - 200 deg C, preferably 0~180deg Cvicinity , ends at 1 - 10 hours extent.

【0393】

(2)の反応において、使用される溶媒及び塩基性化合物は、前記(1)の反応で用いた溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

また(1)と(2)の反応は、分離することなくワンポットで行うこともできる。

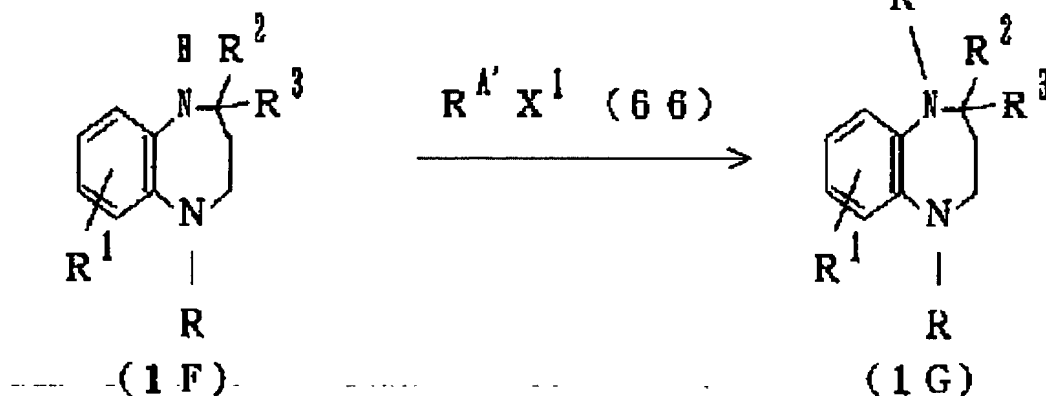
化合物(65)の使用量は、化合物(4)に対して通常等モル～5倍モル、好ましくは等モル～3モル量とするのがよい。

該反応は通常室温～150 deg C、好ましくは、室温～120 deg C 付近にて、0.5～5 時間程度にて終了する。

【0394】

【化 70】

反応式 - 26



【0395】

[式中 R^1 , R^2 , R^3 , R 及び X^1 は前記に同じ。 $\text{R}^{\text{A}'}$ は水素原子以外の R^{A} を示す。]

化合物(1F)と化合物(66)との反応は、前記反応式-2 における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0396】

【化 71】

【0393】

At time of reacting of (2), solvent and basic compound which are used in each case can use solvent and basic compound which are used with reaction of aforementioned (1).

In addition reaction of (1) and (2) can also do with one pot without separating.

As for amount used of compound (65), it is good usually to make the equimole ~5 times mole, preferably equimole ~3molar amount, vis-a-vis compound (4).

said reaction at usually with room temperature ~150deg C, preferably, room temperature ~120deg C vicinity, ends 0.5 - 5 hours extent.

【0394】

[Chemical Formula 70]

【0395】

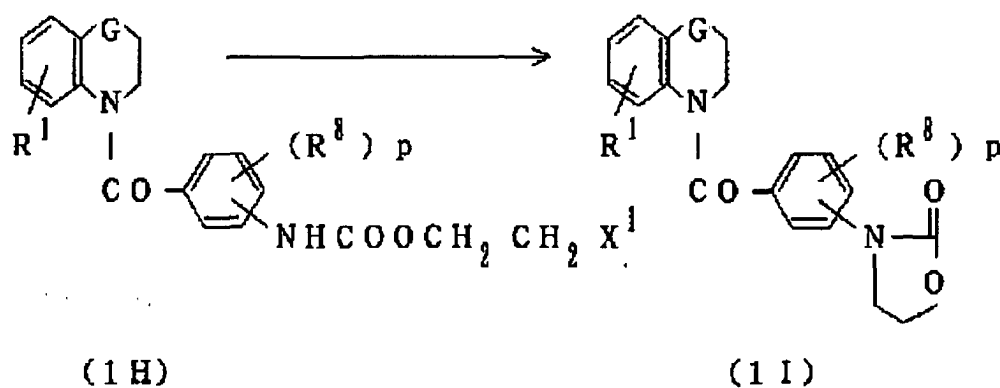
{As for $\text{R}^{\text{sup}1}$, $\text{R}^{\text{sup}2}$, $\text{R}^{\text{sup}3}$, R and $\text{X}^{\text{sup}1}$ in Formula same to description above. $\text{R}^{\text{sup}A'}$ shows $\text{R}^{\text{sup}A}$ other than hydrogen atom. }

compound (1 F) with compound (66) with as for reaction, compound in the aforementioned reaction scheme -2 (4) with compound (6 a) with it is done under the condition which is similar to reaction.

【0396】

[Chemical Formula 71]

反応式- 2 7



【0397】

〔式中 R¹、G、R⁸、p 及び X¹ は前記に同じ。〕

化合物(1H)を化合物(1I)に導く反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0397】

{As for R¹, G, R⁸, p and X¹ in Formula same to description above. }

As for reaction which leads compound (1 H) to compound (1 I), the compound in aforementioned reaction scheme -2 (4) with compound (6 a) with it is done under condition which is similar to reaction.

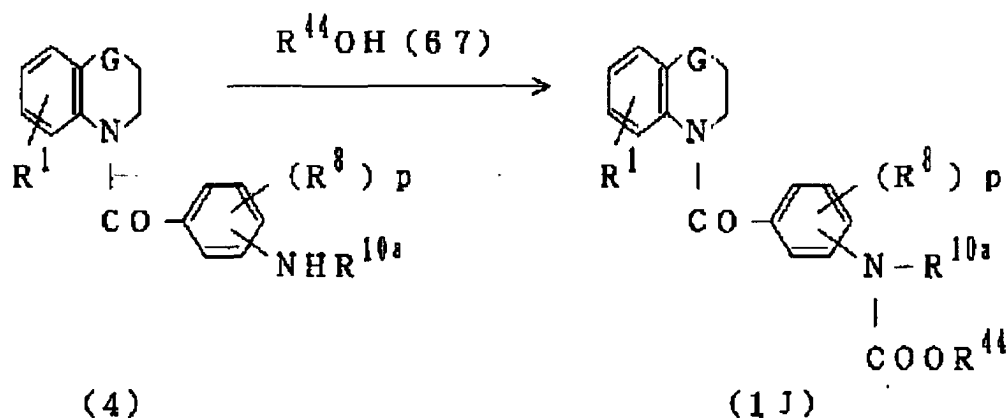
【0398】

【化 72】

反応式- 2 8

【0398】

[Chemical Formula 72]



【0399】

〔式中 R¹、G、R⁸、p 及び R^{10a} は前記に同じ。R⁴⁴ は、置換基としてハロゲン原子を有することのあ

【0399】

{As for R¹, G, R⁸, p and R^{10a} in Formula same to description above. }

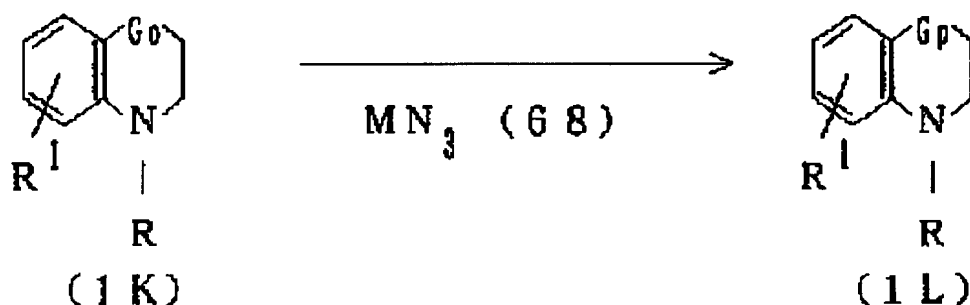
る低級アルキル基、フェノキシ低級アルキル基、フェニル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基、フルオレニル低級アルキル基、低級アルケニル基又はピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルキル基を示す。]

化合物(4)と化合物(67)との反応は、前記反応式-25 における化合物(4)を化合物(1E)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0400】

【化 73】

反応式- 2 9

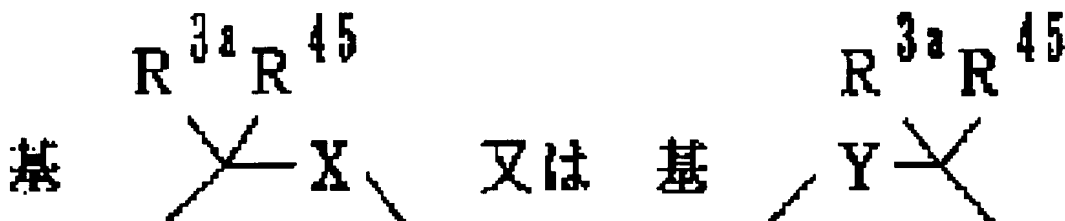


【0401】

【式中 R¹ 及び R は前記に同じ。Go は】

【0402】

【化 74】



【0403】

を示す。

【0404】

R⁴⁴ on lower alkyl group, phenoxy lower alkyl group, phenyl lower alkyl group, pyridyl lower alkyl group, fluorenyl lower alkyl group, lower alkenyl group or piperidine ring which has times when it possesses halogen atom as substituent shows bipyridinyl lower alkyl group which has fact that it possesses group which is chosen from group which becomes lower alkanoyl group, lower alkoxy carbonyl group and lower alkyl group as substituent. }

compound (4) with compound (67) with as for reaction, it is done under condition which is similar to reaction which leads compound (4) in aforementioned reaction scheme -25 to compound (1 E).

【0400】

[Chemical Formula 73]

【0401】

{As for R¹ and R in Formula same to description above. As for Go }

【0402】

[Chemical Formula 74]

【0403】

It shows.

【0404】

Gp は

【0405】

【化 75】

As for Gp

【0405】

[Chemical Formula 75]



【0406】

を示す。

ここで R^{3a}、X 及び Y は前記に同じ。R⁴⁵ はシアノ置換低級アルキル基を示す。R⁴⁶ はテトラゾリル基置換低級アルキル基を示す。

M はナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。

]

化合物(1K)を化合物(1L)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に化合物(1K)を化合物(68)と反応させることにより行なわれる。

ここで使用される溶媒としては、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、無水酢酸、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の極性溶媒等を例示できる。

ここで使用される塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、金属ナトリウム、金属カリウム、ナトリウムアミド等の無機塩基、N,N-ジメチルアニリン、ピペリジン、ピリジン、トリエチルアミン、酢酸ナトリウム、酢酸カリ

【0406】

It shows.

Here as for R^{3a}, X and Y same to description above.R⁴⁵ shows cyano substituted lower alkyl group .R⁴⁶ shows tetrazolyl group substituted lower alkyl group .

M shows sodium , potassium or other alkali metal .

)

Reaction which leads compound (1 K) to compound (1 L), is done the compound (1 K) in suitable solvent and under existing of basic compound compound (68)with by reacting.

for example chloroform , dichloromethane , dichloroethane , carbon tetrachloride or other halogenated hydrocarbons , methanol , ethanol , isopropanol or other alcohols , benzene , toluene , xylene or other aromatic hydrocarbons , dioxane , diethylene glycol dimethyl ether , diethyl ether , tetrahydrofuran or other ethers , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone , acetic anhydride , acetonitrile , dimethyl sulfoxide , hexamethyl phosphoric acid triamide or other polar solvent etc can be illustrated as solvent which is used here.

for example sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , potassium hydrogen carbonate , potassium carbonate , sodium methoxide , sodium ethoxide , sodium hydride , metallic sodium , metal potassium , sodium amide or other inorganic base , N, N- dimethyl aniline , piperidine , pyridine , triethylamine , sodium acetate , potassium acetate or other organic base etc can be illustrated as basic compound which is

ウム等の有機塩基等を例示できる。

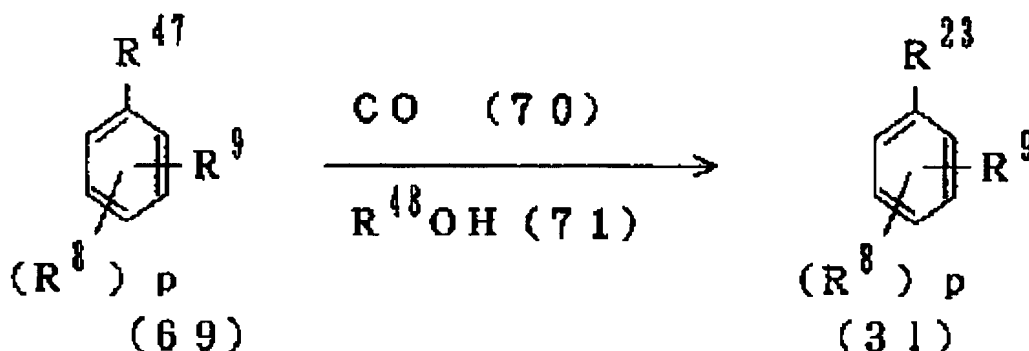
化合物(68)の使用量は、化合物(1K)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～5 倍モル量とするのがよい。

該反応は通常室温～200 deg C、好ましくは 50～150 deg C 付近にて、1～40 時間程度にて終了する。

[0407]

[化 76]

反応式－ 3 0



[0408]

[式中 R⁸、p、R⁹ 及び R²³ は前記に同じ。R⁴⁷ はハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニルオキシ基を示す。R⁴⁸ は低級アルキル基を示す。]

化合物(69)、一酸化炭素(70)及び化合物(71)の反応は、適当な溶媒中触媒及び塩基性化合物の存在下反応させることにより行なわれる。

ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応式-1 における化合物(2)と化合物(3)の反応の内、カルボン酸ハライドを用いる方法で例示された溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

触媒としては、酢酸パラジウム、1,3-ビス(ジフェニルフォスフィノ)プロパン(dppp)等を例示できる。

該反応は、通常室温～200 deg C、好ましくは室温～150 deg C 付近にて、1～10 時間程度に終了する。

化合物(70)、化合物(71)及び触媒は、化合物(69)に対して通常それぞれ大過剰量使用するの

used here.

As for amount used of compound (68), it is good to make equimole, preferably equimole ~5 times molar amount atleast, vis-a-vis compound (1 K).

said reaction at usually with room temperature ~200deg C, preferably 50~150deg Cvicinity, ends 1 - 40 hour extent.

[0407]

[Chemical Formula 76]

[0408]

{As for R⁸, p, R⁹ and R²³ in Formula same to description above. R⁴⁷ shows lower alkyl sulfonyloxy group which has fact that it possesses the halogen atom. R⁴⁸ shows lower alkyl group. }

compound (69), carbon monoxide (70) and reaction of compound (71) is done the catalyst in suitable solvent and by under existing of basic compound reacting.

compound in aforementioned reaction scheme -1 as solvent and basic compound whichare used here, (2) with among reactions of compound (3), solvent and basic compound which were illustrated with method which uses carboxylic acid halide can be used in each case.

As catalyst, palladium acetate, 1,3- bis (diphenylphosphino) propane (dppp) etc can be illustrated.

said reaction, in usually with room temperature ~200deg C, preferably room temperature ~150deg Cvicinity, ends 1 - 10 hours extent.

compound (70), compound (71) and as for catalyst, it is good large excess to use usually respectively vis-a-vis compound

JP1997221476A

1997-8-26

がよい。

(69).

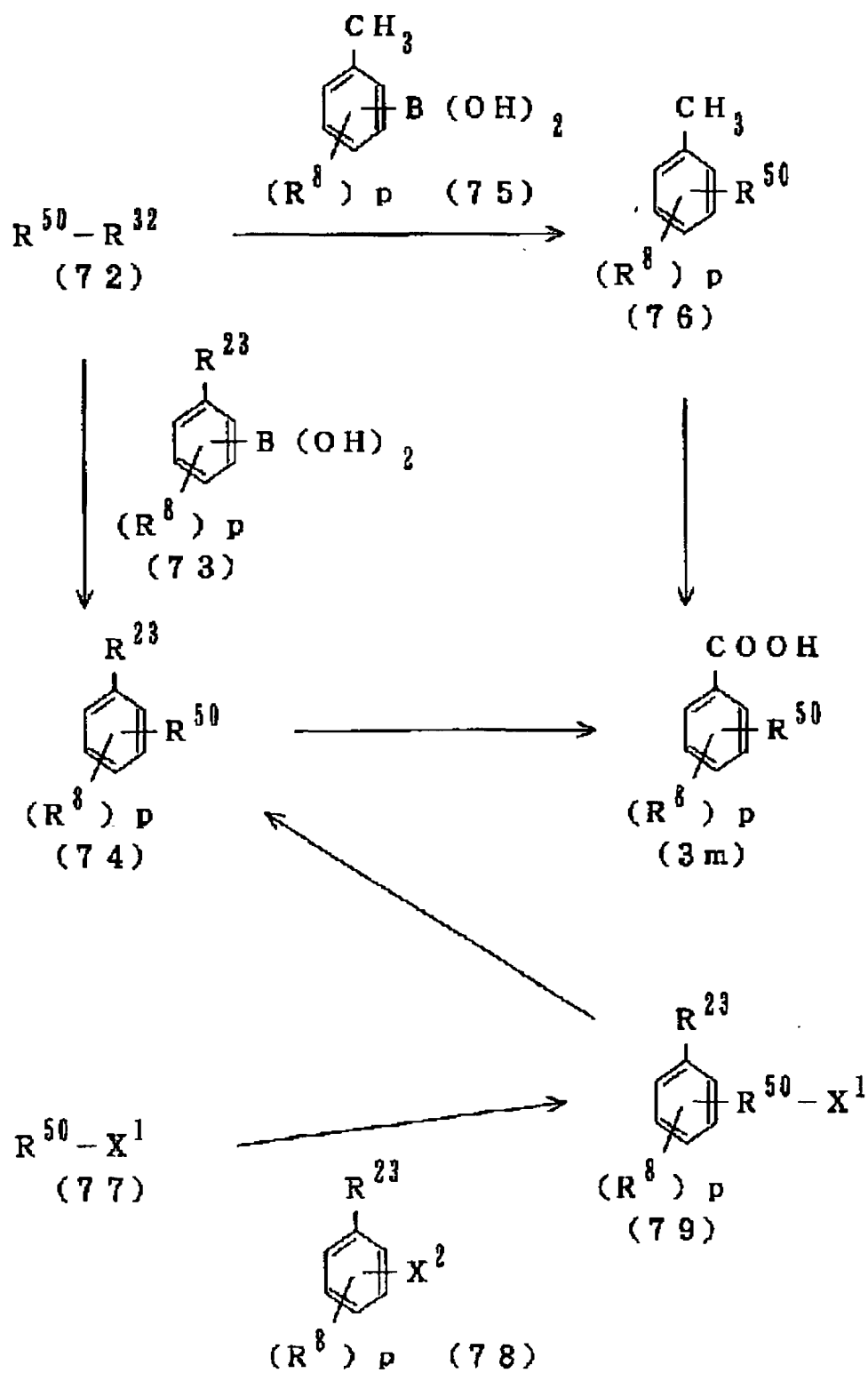
【0409】

[0409]

【化 77】

[Chemical Formula 77]

反応式- 3 1



【0410】

[式中 R^{50} は窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する飽和もしくは不飽和の5~11員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有していてもよい。)を示す。 R^{32} 、 R^2 、 R^8 、 p 、 X^1 及び X^2 は前記に同じ。]

化合物(72)と化合物(73)との反応は、前記反応式-21における化合物(54)と化合物(55)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0411】

化合物(74)を化合物(3m)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0412】

化合物(72)と化合物(75)との反応は、前記反応式-21における化合物(54)と化合物(55)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0413】

化合物(76)を化合物(3m)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は不存在下及び酸化剤の存在下に行われる。

ここで使用される溶媒及び酸化剤は、前記反応式-12における化合物(34)を化合物(35)に導く反応と同様の溶媒、酸化剤を例示できる。

酸化剤の使用量は、化合物(76)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル~4倍モル量とするのがよい。

また使用される塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等を例示できる。

該反応は、通常 0~150 deg C 程度、好ましくは 0~120 deg C 程度にて行われ、一般に 1~7 時間程度で終了する。

【0414】

化合物(77)から化合物(79)を導く反応は、化合物(77)を適当な溶媒中、塩基性化合物の存在

【0410】

{ R^{50} in Formula shows monocycle of 5 - 11 member rings of the saturated or unsaturated which 1 - 4 possesses nitrogen atom, oxygen atom or sulfur atom or heterocyclic group (As substituent becomes lower alkyl group, phenyl group, lower alkanoyl group, halogen atom, phenyl lower alkyl group and oxo group 1 - 3 it is possible to said heterocyclic group to have possessed group which is chosen from group which.) of binary ring. As for R^{32} , R^{23} , R^{8} , p , X^1 and X^2 same to description above. }

compound (72) with compound (73) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -21 (54) with compound (55) with it is done under the reaction condition which is similar to reaction.

【0411】

As for reaction which leads compound (74) to compound (3 m), it is done under reaction condition which is similar to reaction which leads the compound (1 o) in aforementioned reaction scheme -7 to compound (1 p).

【0412】

compound (72) with compound (75) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -21 (54) with compound (55) with it is done under the reaction condition which is similar to reaction.

【0413】

Reaction which leads compound (76) to compound (3 m), is done in the suitable solvent, under existing of basic compound or under absence and under existing of oxidant.

As for solvent and oxidant which are used here, solvent, oxidant which is similar to reaction which leads compound (34) in aforementioned reaction scheme -12 to compound (35) can be illustrated.

As for amount used of oxidant, it is good to make equimole, preferably equimole ~4-fold molar amount at least, vis-a-vis compound (76).

In addition for example sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride etc can be illustrated as basic compound which is used.

said reaction, is done at usually 0 - 150 deg C extent, and preferably 0~120deg C extent ends generally at 1 - 7 hours extent.

【0414】

Reaction which leads compound (79) from compound (77), after in the suitable solvent and under existing of basic

下、通常-80~50 deg C、好ましくは-80 deg C~室温付近にて一般に 0.5~5 時間程度処理した後、同様の溶媒中、亜鉛、塩化亜鉛等の亜鉛化合物、触媒及び塩基性化合物の存在下、化合物(78)を反応させることにより行われる。

化合物(77)の処理時に使用される塩基性化合物としては、例えばメチルリチウム、n-ブチルリチウム、フェニルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等のアルキル及びアリーールリチウム又はリチウムアミド類等が挙げられる。

また化合物(78)との反応時に使用される塩基性化合物としては、ジイソプロピルエチルアミンに加えて、前記反応式-1 における化合物(3)のカルボン酸ハライドとアミン(2)との反応で用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。

化合物(77)の処理時及び化合物(78)との反応時の塩基性化合物の使用量は、化合物(77)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル~2 倍モル量とするのがよい。

また亜鉛化合物の使用量は、化合物(77)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル~2 倍モル量とするのがよい。

使用される溶媒及び触媒、並びに触媒、化合物(77)及び化合物(78)の使用量は、前記反応式-1 における化合物(21)と化合物(22)との反応と同様の反応条件下に行われる。

該反応は、通常 0~150 deg C、好ましくは 0~10 0 deg C 付近にて行われ、一般に 1~10 時間程度で終了する。

[0415]

化合物(79)を化合物(74)に導く反応は、適当な溶媒中、接触還元触媒を用いて還元することにより行われる。

使用される溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、N,N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

また使用される接触還元触媒としては、例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ランネーニッケル

compound, with usually - 0.5 - 5 hours extent treating compound (77) generally 80 - 50 deg C, preferably -80deg C~room temperature vicinity, in similar solvent, under existing of zinc, zinc chloride or other zinc compound, catalyst and basic compound, is done compound (78) by reacting.

for example methyl lithium, n- butyl lithium, phenyl lithium, lithium diisopropyl amide or other alkyl and you can list aryl lithium or lithium amides etc as basic compound which is used when treating compound (77).

In addition carboxylic acid halide and amine of compound (3) in theaforementioned, reaction scheme -1 in addition to diisopropyl ethylamine compound (78) with as basic compound which is used when reacting, (2) with basic compound which is used with reaction can be used in each case.

When treating compound (77) and compound (78) with as for amount used of basic compound when reacting, it is good to make equimole, preferably equimole ~2-fold molar amount usually atleast, vis-a-vis compound (77).

In addition as for amount used of zinc compound, it is good to make the equimole, preferably equimole ~2-fold molar amount usually at least, vis-a-vis compound (77).

solvent and catalyst, and catalyst, compound which are used (77) and as for the amount used of compound (78), compound in aforesaid reaction scheme -11 (21) with compound (22) with it is done under reaction condition which is similar to reaction.

said reaction is done with usually 0 - 150 deg C, preferably 0~100deg C vicinity, ends generally at 1- 10 hours extent.

[0415]

Reaction which leads compound (79) to compound (74) is done by reducing in suitable solvent, making use of catalytic reduction catalyst.

You can list for example water and acetic acid, methanol, ethanol, isopropanol or other alcohols, hexane, cyclohexane or other hydrocarbons, dioxane, tetrahydrofuran, diethyl ether, diethylene glycol dimethyl ether or other ethers, ethylacetate, methyl acetate or other esters, N, N-dimethylformamide or other aprotic polar solvent or these mixed solvent etc as the solvent which is used.

In addition you can list for example palladium, palladium - black and palladium - carbon, platinum, platinum oxide, copper chromite, raney nickel etc as catalytic reduction

等が挙げられる。

斯かる触媒は、出発原料に対して一般に0.02~1倍量程度用いるのがよい。

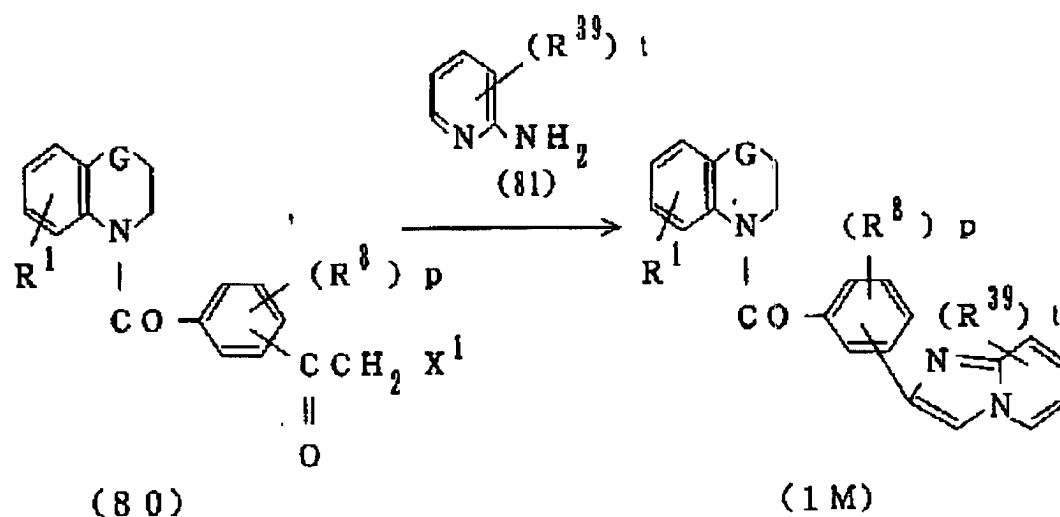
また該反応の反応系内には酢酸ナトリウム等を添加してもよい。

反応温度は通常-20~150 deg C 付近、好ましくは0~100 deg C 付近、水素圧は通常1~10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5~10時間程度で終了する。

[0416]

[化 78]

反応式- 3 2



[0417]

{式中、R¹、G、R⁸、p、X¹、R³⁹及びtは前記に同じ。}

化合物(80)と化合物(81)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0418]

[化 79]

catalyst which is used.

As for such catalyst, generally 0.02 - 1 - fold amount it is good vis-a-vis starting material to use.

In addition it is possible to add sodium acetate etc inside reaction system of said reaction.

As for reaction temperature as for usually - 20 - 150 deg C vicinity, preferably 0~100deg C vicinity, hydrogen pressure it is good to make usually 1 - 10 atmosphere, said reaction ends generally at 0.5 - 10 hours extent.

[0416]

[Chemical Formula 78]

[0417]

{In Formula, as for R¹, G, R⁸, p, X¹, R³⁹ and t same to description above. }

compound (80) with compound (81) with as for reaction, compound in theaforementioned reaction scheme -2 (4) with compound (6 a) with it is done under the reaction condition which is similar to reaction.

[0418]

[Chemical Formula 79]

$$\begin{array}{ccc}
 \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{R}^{51}-\text{C}(\text{CH}_2) \text{C}-\text{R}^{52} \\ \text{(82)} \end{array} & \xrightarrow{\quad} & \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{R}^{51}-\text{C}(\text{CH}_2) \text{C}-\text{R}^{52} \\ \text{(82)} \end{array} \\
 \begin{array}{c} \text{G} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{N} \\ | \\ \text{CO} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{NH}_2 \\ \text{(4a)} \end{array} & & \begin{array}{c} \text{G} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{N} \\ | \\ \text{CO} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{R}^{51} \text{---} \text{R}^{52} \\ \text{(1N)} \end{array}
 \end{array}$$

[0419]

{In Formula, as for R¹, G, R⁸ and p same to description above. R⁵¹ and R⁵² show lower alkyl group respectively. }

compound (4 a) with compound (82) with it can execute reaction, in the suitable solvent and under existing of acid .

You can list for example water and these mixed solvent etc of methanol, ethanol, isopropanol or other lower alcohols, acetone, methylethyl ketone or other ketones, dioxane, tetrahydrofuran, ethyleneglycol dimethyl ether or other ethers, acetic acid, formic acid or other aliphatic acid, as the solvent which is used here.

In addition you can list for example hydrochloric acid , sulfuric acid , hydrobromic acid or other mineral acid , formic acid , acetic acid , aromatic sulfonic acid or other organic acid etc as acid which is used.

As for amount used of compound (82), it is good to make equimole, preferably equimole ~2-fold molar amount usually at least, vis-a-vis compound (4a).

It advances said reaction usually ideally at room temperature ~200deg C extent, and preferably room temperature ~150deg C extent ends generally at 0.5 - 5 hours extent.

[0420]

In above-mentioned General Formula (1), compound where R^{1} is the hydroxy group can also obtain

化合物を脱アルキル化反応させることにより得ることもできる。

この脱アルキル反応は適当な溶媒中酸の存在下にて行なわれる。

溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等の低級アルコール類、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等の極性溶媒、酢酸等の有機酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。

酸としては例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸類、三弗化ホウ素、塩化アルミニウム、三臭化ホウ素等のルイス酸、沃化ナトリウム、沃化カリウム等の沃化物、上記ルイス酸と沃化物の混合物等を挙げることができる。

該反応は通常室温~150 deg C、好ましくは室温~120 deg Cにて好適に進行し、一般に0.5~15時間程度で終了する。

【0421】

上記一般式(1)において、R⁹がフェニル環上にフェニル低級アルコキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物の場合、この化合物を接触還元することにより対応するR⁹がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物に導くことができる。

該接触還元は、適当な溶媒中還元剤の存在下に行なわれる。

ここで使用される溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、酢酸、酢酸エチル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類等又はこれらの混合溶媒等を例示できる。

還元剤としては、パラジウム黒、パラジウム炭素、酸化白金、白金黒、白金炭素、ラネーニッケル等の接触還元触媒を用いることができる。

該反応は、通常常圧~20気圧、好ましくは常圧~10気圧の水素雰囲気中、通常-30~100 deg C、好ましくは0~60 deg Cの温度で行なわれる。

触媒の使用量としては、原料化合物に対して通常0.1~40重量%、好ましくは0.1~20重量%とするのがよい。

compound where R¹ which corresponds is lower alkoxy group dealkylation by reacting.

this dealkylation reaction is done under existing of acid in suitable solvent .

for example water and these mixed solvent etc of methanol , ethanol , isopropyl alcohol or other lower alcohols , dioxane , tetrahydrofuran or other ethers , dichloromethane , chloroform , carbon tetrachloride or other halogenated hydrocarbons , acetonitrile or other polar solvent , acetic acid or other organic acid , can be listed as the solvent .

for example hydrochloric acid , sulfuric acid , hydrobromic acid or other mineral acid , boron trifluoride , aluminum chloride , boron tribromide or other Lewis acid , sodium iodide , potassium iodide or other iodide , above-mentioned Lewis acid and mixture etc of iodide can belisted as acid .

It advances said reaction usually ideally with room temperature ~150deg C, preferably room temperature ~120deg C, ends generally at 0.5 - 15 hour extent.

[0421]

In above-mentioned General Formula (1), when it is a compound which shows the phenyl group where R⁹ at least one has phenyl lower alkoxy group on phenyl ring , it is possible to lead to compound which shows phenyl group where R⁹ which corresponds by catalytic reduction doing this compound at least one has hydroxy group on phenyl ring .

said catalytic reduction is done under existing of reductant in suitable solvent .

for example water and methanol , ethanol , isopropanol or other alcohols , acetic acid , ethylacetate , dioxane , tetrahydrofuran , diethyl ether , diglyme or other ethers , benzene , toluene , xylene or other aromatic hydrocarbons etc or these mixed solvent etc can be illustrated as solvent which is used here.

As reductant , palladium black , palladium-carbon , platinum oxide , platinum black , platinum carbon , raney nickel or other catalytic reduction catalyst can be used.

said reaction, usually in hydrogen atmosphere of ambient pressure ~20atmosphere , preferably ambient pressure ~10atmosphere , of usually - is done with temperature 30 - 100 deg C, preferably 0~60deg C.

As amount used of catalyst , it is good to make usually 0.1 - 40 weight % , preferably 0.1 ~20weight % , vis-a-vis starting material compound .

[0422]

上記一般式(1)において、 R^9 がフェニル環上に低級アルカノイルオキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物又は R^9 が低級アルカノイルオキシ基を示す化合物である場合、これらの化合物を加水分解することにより対応する R^9 がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物又は R^9 が水酸基を示す化合物に導くことができる。

この加水分解は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下に実施することができる。

用いられる溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、ギ酸、酢酸等の脂肪酸類、及びこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。

該反応は通常室温~200 deg C 程度、好ましくは室温~150 deg C 程度にて好適に進行し、一般に0.5~25 時間程度で終了する。

[0423]

上記一般式(1)において、 R^8 が低級アルコキシ基である化合物の場合、この化合物を脱アルキル化反応させることにより対応する R^8 が水酸基である化合物に導くことができる。

また R^9 がフェニル環上に低級アルコキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物(1)の場合も、同様に脱アルキル化反応させることにより、対応する R^9 がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基である化合物に導くことができる。

この脱アルキル化反応は、適当な溶媒中酸の存在下にて行なわれる。

溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等の低級アルコール類、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素

[0422]

In above-mentioned General Formula (1), when it is a compound where compound or $R^{⁹}$ which shows phenyl group where $R^{⁹}$ at least one has the lower alkanoyl oxy group on phenyl ring shows lower alkanoyl oxy group, It is possible to lead to compound where compound or $R^{⁹}$ which shows phenyl group where $R^{⁹}$ which corresponds by hydrolysis doing these compound at least one has hydroxy group on phenyl ring shows hydroxy group.

With in or solventless suitable solvent, it can execute this hydrolysis, under existing of acid or base characteristic compound.

for example water, methanol, ethanol, isopropanol or other lower alcohols, acetone, methylethyl ketone or other ketones, dioxane, tetrahydrofuran, ethyleneglycol dimethyl ether or other ethers, formic acid, acetic acid or other fatty acids, and these mixed solvent etc can be listed as the solvent which is used.

It can list for example hydrochloric acid, sulfuric acid, hydrobromic acid or other mineral acid and formic acid, acetic acid, aromatic sulfonic acid or other organic acid etc as acid, in addition as basic compound for example sodium carbonate, potassium carbonate or other metal carbonate and lithium hydroxide, sodium hydroxide, potassium hydroxide, calcium hydroxide or other metal hydroxide etc it can list.

It advances said reaction usually ideally at room temperature ~200deg C extent, and preferably room temperature ~150deg C extent ends generally at 0.5 - 25 hour extent.

[0423]

In above-mentioned General Formula (1), when it is a compound where $R^{⁸}$ is lower alkoxy group, to lead to compound where $R^{⁸}$ which corresponds the dealkylation by reacting is hydroxy group it is possible this compound.

In addition when it is a compound (1) which shows phenyl group where the $R^{⁹}$ at least one has lower alkoxy group on phenyl ring, it is possible to lead to compound which is a phenyl group where $R^{⁹}$ which corresponds in the same way dealkylation by reacting, at least one has hydroxy group on phenyl ring.

this dealkylation reaction is done under existing of acid in suitable solvent.

for example water, methanol, ethanol, isopropyl alcohol or other lower alcohols, dioxane, tetrahydrofuran or other ethers, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride or other halogenated hydrocarbons, acetonitrile or other polar

等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等の極性溶媒、酢酸等の有機酸、又はこれらの混合溶媒を挙げることができる。

酸としては例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸類、三弗化ホウ素、塩化アルミニウム、三臭化ホウ素等のルイス酸、沃化ナトリウム、沃化カリウム等の沃化物、上記ルイス酸と沃化物の混合物等を挙げることができる。

該反応は通常室温~150 deg C、好ましくは室温~120 deg Cにて好適に進行し、一般に0.5~15時間程度で終了する。

[0424]

一般式(1)の化合物において、 R^{11} がフェニル環上に置換基としてアミノ基を少なくとも一つ有するフェノキシ低級アルカノイル基を示す化合物である場合、この化合物と一般式 $R^{41}X^{11}$ (10a)(式中、 R^{41} は低級アルキル基を示す。 X^{11} は前記に同じ。)で表わされる化合物又は一般式 $R^{16}CO$ R^{17} (11)(式中、 R^{16} 及び R^{17} は前記に同じ。)で表わされる化合物とを、反応式-4における化合物(1h)と化合物(10)又は化合物(11)の反応と同様の条件下に反応させて、対応する R^{11} がフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有するアミノ基を少なくとも一つ有するフェノキシ低級アルカノイル基である化合物に導くことができる。

[0425]

一般式(1)の化合物において、 R^9 が置換又は未置換の窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する飽和又は不飽和の5員~11員環の単環又は二項環の複素環基であって、その複素環基が骨格に二級のアミノ基を有している化合物の場合、この化合物を一般式 $R^{42}X$ (10b)(式中、 X は前記に同じ。 R^{42} は低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)で表わされる化合物又は一般式 $R^{16}C$ OR^{17} (11)(式中、 R^{16} 及び R^{17} は前記に同じ)で表わされる化合物と、反応式-4における化合物(1h)と化合物(10)又は化合物(11)との反応と同様の条件下に反応させて、対応する R^9 の複素環残基の二級のアミノ基に、低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又は低級アルカノイル基が置換した複素環残基を有する化合物に導くことができる。

solvent, acetic acid or other organic acid, or these mixed solvent can be listed as solvent.

for example hydrochloric acid, sulfuric acid, hydrobromic acid or other mineral acid, boron trifluoride, aluminum chloride, boron tribromide or other Lewis acid, sodium iodide, potassium iodide or other iodide, above-mentioned Lewis acid and mixture etc of iodide can belisted as acid.

It advances said reaction usually ideally with room temperature ~150deg C, preferably room temperature ~120deg C, endsgenerally at 0.5 - 15 hour extent.

[0424]

In compound of General Formula (1), when R^{11} is a phenyl ring, it is a compound which shows phenoxy lower alkanoyl group which at least one possesses amino group as substituent on the phenyl ring, compound which is displayed with this compound and General Formula $R^{41}X^{11}$ (10 a) (In Formula, R^{41} shows lower alkyl group. As for X^{11} same to description above.) or compound which is displayed with General Formula $R^{16}COR^{17}$ (11) (In Formula, as for R^{16} and R^{17} same to description above.), compound in reaction scheme -4 (1 h) with compound (10) or reacting under the condition which is similar to reaction of compound (11), R^{11} which corresponds can lead to compound which is a phenoxy lower alkanoyl group which the at least one possesses amino group which possesses lower alkyl group as substituent on phenyl ring.

[0425]

In compound of General Formula (1), when with monocycle of saturated or unsaturated 5-member ~11 membering where R^9 1 - 4 has nitrogen atom, oxygen atom or sulfur atom of substituted or unsubstituted or heterocyclic group of binary ring, it is a compound where heterocyclic group has had amino group of the secondary in skeleton, compound which is displayed this compound with the General Formula $R^{42}X$ (10 b) (In Formula, as for X same to description above. R^{42} shows lower alkyl group, phenyl lower alkyl group or lower alkanoyl group.) or compound which is displayed with General Formula $R^{16}COR^{17}$ (11) (In Formula, as for R^{16} and R^{17} same to description above) and, compound in reaction scheme -4 (1 h) with compound (10) or compound (11) withreacting under condition which is similar to reaction, to amino group of secondary of heterocycle residue of R^9 which corresponds, is possible thefact that it leads to compound which possesses heterocycle residue which the lower alkyl

また、一般式 $R^{43}OH(12a)$ (R^{43} は低級アルカノイル基を示す。) で表わされる化合物とを、反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に反応させて、対応する R^9 の複素環残基の二級のアミノ基に低級アルカノイル基が置換した複素環残基を有する化合物に導くことができる。

【0426】

本発明の化合物(1)の内、酸性基を有する化合物は、薬理的に許容し得る塩基性化合物と塩を形成し得る。

かかる塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩又は重炭酸塩、ナトリウムメチラート、カリウムエチラート等のアルカリ金属アルコラート等を例示することができる。

また、本発明の化合物(1)中、塩基性を有する化合物は、通常の薬理的に許容される酸と容易に塩を形成し得る。

かかる酸としては、例えば硫酸、硝酸、塩酸、臭化水素酸等の無機酸、酢酸、p-トルエンスルホン酸、エタンスルホン酸、シユウ酸、マレイン酸、フマル酸、クエン酸、コハク酸、安息香酸等の有機酸を例示できる。

之等の塩もまた遊離形態の化合物(1)と同様に本発明において有効成分化合物として用いることができる。

尚、上記化合物(1)には、立体異性体、光学異性体が包含されるが、之等も同様に有効成分化合物として用いることができる。

【0427】

上記各反応式に示される方法により得られる目的とする化合物は、通常分離手段により反応系内より分離され、更に精製することができる。

この分離及び精製手段としては、例えば蒸留法、再結晶法、カラムクロマトグラフィー、イオン交換クロマトグラフィー、ゲルクロマトグラフィー、親和クロマトグラフィー、プレパラティブ薄層クロマトグラフィー、溶媒抽出法等を採用できる。

group, phenyl lower alkyl group or lower alkanoyl group substitutes.

In addition, compound in compound which is displayed with General Formula $R^{43}OH(12a)$ (R^{43} shows lower alkanoyl group.), reaction scheme -1 (2) with compound (3) with reacting under condition which is similar to reaction, it is possible to lead to compound which possesses heterocycle residue which lower alkanoyl group substitutes in amino group of secondary of heterocycle residue of R^9 which corresponds.

【0426】

Among compound (1) of this invention, compound which possesses acidic group can form pharmacologically acceptable salt basic characteristic compound and salt.

As this basic compound, it is possible to illustrate for example sodium hydroxide, potassium hydroxide, lithium hydroxide, calcium hydroxide or other metal hydroxide, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate or other alkali metal carbonate salt or bicarbonate ion, sodium methylete, potassium ethylete or other alkali metal alcoholate etc.

In addition, in compound (1) of this invention, compound which possesses basic in conventional pharmacological can form salt in acceptable acid and easy.

As this acid, for example sulfuric acid, nitric acid, hydrochloric acid, hydrobromic acid or other inorganic acid, acetic acid, p-toluenesulfonic acid, ethane sulfonic acid, citric acid, maleic acid, fumaric acid, citric acid, succinic acid, benzoic acid or other organic acid can be illustrated.

Also Itaru or other salt and compound of free form (1) with regarding to this invention in same way, you can use as active ingredient compound.

Furthermore, configurational isomer, optical isomer is included in above-mentioned compound (1), but in same way you can use also Itaru etc as active ingredient compound.

【0427】

compound which is made objective which is acquired by method which is shown in above-mentioned each reaction scheme can be separated from inside reaction system by conventional separation means, furthermore can refine.

As this separation and purification means, for example distillation method, recrystallization method, column chromatography, ion exchange chromatography, gel chromatography, friendship chromatography, preparative thin layer chromatography, solvent extraction method etc can be adopted.

【0428】

かくして得られる有効成分化合物は、バソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤及びバソプレシン作動剤として有効であり、該これら薬剤は、一般的な医薬製剤の形態で用いられる。

製剤は通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。

この医薬製剤としては各種の形態が治療目的に応じて選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤(液剤、懸濁剤等)等が挙げられる。

錠剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来よりよく知られている各種のものを広く使用することができる。

その例としては、例えば乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カリシウム、カオリン、結晶セルロース、ケイ酸等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、カンテン末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等を使用できる。

さらに錠剤は必要に応じ通常の剤皮を施した錠剤、例えば糖衣錠、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。

丸剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用できる。

その例としては、例えばブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、カンテン

【0428】

As for active ingredient compound which is acquired in this way, being effective as the vasopressin antagonist, oxytocin antagonist and vasopressin work working agent, as for these chemical of the said, it is used with form of general pharmaceutical formulation.

formulation is manufactured making use of filler, extender, binder, attaching moisture agent, disintegrating agent, surfactant, lubricant or other diluent or vehicle which usually is used.

As this pharmaceutical formulation be able to select various form, making representative ones, you can list tablets, pill, powder, liquid, suspension, emulsion, granule, capsules, suppository, injectable (liquid, suspension etc) etc according to treatment objective.

When it forms in form of tablets, various ones which are wellknown from until recently with this field as carrier can be used widely.

As example, for example lactose, sucrose, sodium chloride, fructose, urea, starch, calcium carbonate, kaolin, crystalline cellulose, silicic acid or other vehicle, water, ethanol, propanol, single syrup, fructose solution, starch liquid, gelatin solution, carboxymethyl cellulose, shellac, methylcellulose, potassium phosphate, polyvinyl pyrrolidone or other binder, drying starch, sodium alginate, agar powder, laminarin powder, sodium hydrogen carbonate, calcium carbonate, polyoxyethylene sorbitan fatty acid esters, sodium lauryl sulfate, stearic acid monoglyceride, starch, lactose or other disintegrating agent, sucrose, stearin, cocoa butter, hydrogenated oil or other breakdown inhibitor, quaternary ammonium salt group, sodium lauryl sulfate or other absorption promotor, glycerin, starch or other humectant, starch, lactose, kaolin, bentonite (DANA 71.3.1a.1-2), colloidal silicic acid or other adsorbent, purified talc, stearate, boric acid end, polyethylene glycol or other lubricant etc can be used.

Furthermore it can designate tablets as tablets, for example sugar-coated tablet, gelatin capsule, stomach-soluble coated tablet, film-coated tablet or double pill, multilayer pill which administers conventional coating according to need.

When it forms in form of pill, those of prior public knowledge can be used widely with this field as carrier.

As example, for example fructose, lactose, starch, cacao butter, hardened vegetable oil, kaolin, talc or other vehicle, gum arabic powder, tragacanth powder, gelatin, ethanol or other binder, laminarin, agar or other disintegrating agent etc

等の崩壊剤等を使用できる。

坐剤の形態に成形するに際しては、担体として従来公知のものを広く使用できる。

その例としては、例えばポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等を挙げることができる。

カプセル剤は常法に従い通常有効成分化合物を上記で例示した各種の担体と混合して硬質ゼラチンカプセル、軟質カプセル等に充填して調製される。

注射剤として調製される場合、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、且つ血液と等張であるのが好ましく、これらの形態に成形するに際しては、希釈剤としてこの分野において慣用されているものをすべて使用でき、例えば水、エチルアルコール、マクロゴール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類等を使用できる。

なお、この場合等張性の溶液を調製するに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有せしめてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を添加してもよい。

更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を医薬製剤中に含有させることもできる。

[0429]

本発明の医薬製剤中に含有されるべき有効成分化合物の量としては、特に限定されず広範囲から適宜選択されるが、通常製剤組成物中に約1~70重量%、好ましくは約5~50重量%とするのがよい。

[0430]

本発明の医薬製剤の投与方法は特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等に応じた方法で投与される。

例えば錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には、経口投与される。

また注射剤の場合には単独で又はブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内投与され、更に必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮

can be used.

When it forms in form of suppository, those of prior public knowledge can be used widely as carrier.

As example, esters, gelatin, semisynthetic glyceride etc of for example polyethylene glycol, cacao butter, higher alcohol, higher alcohol can be listed.

capsules, mixing with various carrier which usually illustrated the active ingredient compound at description above in accordance with conventional method being filled in hard gelatin capsule, flexible capsule etc, it is manufactured.

When it is manufactured, as injectable, liquid, emulsion and suspension to be done, be able to use those which common use are done entirely in the this field as diluent disinfection that at same time it is a blood and a isotonic to be desirable, when it forms in these form, for example water and ethyl alcohol, macrogol, propylene glycol, ethoxylated isostearyl alcohol, polyoxy conversion isostearyl alcohol, polyoxyethylene sorbitan fatty acid esters etc can be used.

Furthermore, in case of this solution of isotonicity is manufactured in pharmaceutical formulation to be possible to contain salt, fructose or the glycerin of satisfactory amount, in addition it is possible to add conventional solubilizer, buffer, anesthetic etc.

Furthermore according to need colorant, preservative, fragrance, flavor agent, sweetener etc and it is possible also to contain other drug in pharmaceutical formulation.

[0429]

Especially it is not limited as quantity of active ingredient compound which it should contain in pharmaceutical formulation of this invention, is appropriately selected from broad range, but it is good usually to make approximately 1 - 70 weight %, preferably approximately 5 - 50 weight % in formulation composition.

[0430]

As for administration method of pharmaceutical formulation of this invention as for especially restriction it is not, it is prescribed with method which to the extent etc of age, gender other condition, disorder of various formulation type, patient responds.

In case of for example tablets, pill, liquid, suspension, emulsion, granule and capsules, oral dosage it is done.

In addition in case of injectable or mixing with fructose, amino acid or other conventional supplemental liquid with the alone, intravenous administration it is done, furthermore

下もしくは腹腔内投与される。

坐剤の場合には直腸内投与される。

【0431】

本発明医薬製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等により適宜選択されるが、通常有効成分化合物の量が、1日当たり体重1kg当り、約0.6~50mg程度とするのが良い。

また投与単位形態の製剤中には有効成分化合物が約10~1000mgの範囲で含有されるのが望ましい。

【0432】

【実施例】

以下、本発明を更に詳細に説明するため、本発明医薬製剤の製剤例を挙げ、次いで該製剤に配合される有効成分化合物の製造のための原料化合物の製造例を参考例として、また上記有効成分化合物の製造例を実施例として挙げ、更に有効成分化合物の試験例を挙げる。

【0433】

製剤例 1

intramuscular , intradermal , subcutaneous or intraperitoneal administration is done with the according to need alone .

In case of suppository intrarectal administration it is done.

【0431】

dose of this invention pharmaceutical formulation is selected appropriately extent etc of age , gender other condition , disorder of administration method , patient by , but usually quantity of the active ingredient compound , making per day body weight per kg , approximately 0.6 - 50 mg extent is good.

In addition it is desirable in formulation of dosage unit form for active ingredient compound to be contained in range of approximately 10 - 1000 mg .

【0432】

[Working Example (s)]

In order below, furthermore to explain this invention in detail, in addition you list Production Example of above-mentioned active ingredient compound , you list the Formulation Example of this invention pharmaceutical formulation , with Production Example of starting material compound for producing the active ingredient compound which is combined next in said formulation as Reference Example , furthermore list Test Example of active ingredient compound as Working Example .

【0433】

Formulation Example 1

7-クロロ-5-〔(4-エチル-1-ピペラジニル)カルボニル										
<seq> (4-ethyl - 1- piperazinyl) carbonyl 7 -chloro - 5-										
メチル〕-1-〔2-メトキシ-					4-(2-メチルフェニル)ベン					
<seq>2 -methoxy - methyl *- 1-					4 - (2 -methylphenyl) [ben]					
ゾイル〕-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン										150 g
[zoiru]) - 2, 3 and 4 and 5 -tetrahydro - 1H- benzo azepine										150 g
アビセル(商標名、旭化成社製)										40g
Avicel (tradename , Asahi Chemical Co. Ltd. (DB 69-067-2662) supplied)										40 g
コーンスターチ										30g

corn starch																		30 g
ステアリン酸マグネシウム																		2g
magnesium stearate																		2 g
ヒドロキシプロピルメチルセルロ	ー	ス																10g
[hidorokishipuropirumechiruseruro]		[su]																10 g
ポリエチレングリコール-6000																		3g
polyethylene glycol - 6000																		3 g
ヒマシ油																		40g
castor oil																		40 g
エタノール																		40g
ethanol																		40 g

本発明有効成分化合物、アビセル、コーンスターチ及びステアリン酸マグネシウムを混合研磨後、糖衣 R10mm のキネで打錠する。

得られた錠剤をヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリエチレングリコール-6000、ヒマシ油及びエタノールからなるフィルムコーティング剤で被覆を行ない、フィルムコーティング錠を製造する。

【0434】

製剤例 2

7-クロロ-5-{{N-(2-ジエチルアミノエチル)-N-メチルアミノ}カルボニルメチル}-1-(3,4-ジメトキシベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 150g クエン酸 1.0g

this invention active ingredient compound , Avicel , corn starch and magnesium stearate after mixture grinding, pill-making are donewith [kine] of sugar coat R10mm .

tablets which it acquires sheath is done with film coating agent whichconsists of hydroxypropyl methylcellulose , polyethylene glycol -6000, castor oil and ethanol , film-coated tablet is produced.

【0434】

Formulation Example 2

7 -chloro -5- { {N- (2 -diethyl aminoethyl) -N- methylamino } carbonyl methyl } - 1 - (3 and 4 -dimethoxy benzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 150gcitric acid 1.0g

ラクトース																		33. 5g
lactose																		33.5 g
リン酸ニカルシウム																		70. 0g
phosphoric acid [nikarushiumu]																		70.0 g
ブルロニックF-68																		30. 0g

pluronic F- 68							30.0 g
ラウリル硫酸ナトリウム							15. 0g
sodium lauryl sulfate							15.0 g
ポリビニルピロリドン							15. 0g
polyvinyl pyrrolidone							15.0 g
ポリエチレングリコール(カルボワックス1500)							4. 5g
polyethylene glycol (carbo wax 1500)							4.5 g
ポリエチレングリコール(カルボワックス6000)							45. 0g
polyethylene glycol (carbo wax 6000)							45.0 g
コーンスターチ							30. 0g
corn starch							30.0 g
乾燥ステアリン酸ナトリウム							3. 0g
Drying sodium stearate							3.0 g
乾燥ステアリン酸マグネシウム							3. 0g
Drying magnesium stearate							3.0 g
エタノール							適量
ethanol							suitable amount

本発明有効成分化合物、クエン酸、ラクトース、リン酸ニカルシウム、プルロニックF-68及びラウリル硫酸ナトリウムを混合する。

【0435】

上記混合物を No.60 スクリーンでふるい、ポリビニルピロリドン、カルボワックス 1500 及び同 6000 を含むアルコール製溶液で湿式粒状化する。

必要に応じてアルコールを添加して粉末をペースト状塊にする。

コーンスターチを添加し、均一な粒子が形成されるまで混合を続ける。

this invention active ingredient compound , citric acid , lactose , dicalcium phosphate , pluronic F-68 and sodium lauryl sulfate are mixed.

[0435]

Above-mentioned mixture wet type granulation is done with alcohol make solution which includes sieve , polyvinyl pyrrolidone , carbo wax. 1500 and same 6000 with No.60screen .

Adding according to need alcohol , it designates powder as paste lump .

Until corn starch is added, uniform particle is formed, mixture is continued.

混合物を No.10 スクリーンを通して、トレイに入れ、100 deg C のオープンで 12~14 時間乾燥する。

乾燥粒子を No.16 スクリーンでふるい、乾燥ラウリル硫酸ナトリウム及び乾燥ステアリン酸マグネシウムを加えて混合し、打錠機で所望の形状に圧縮する。

【0436】

上記の芯部をワニスで処理し、タルクを散布し、湿気の吸収を防止する。

芯部の周囲に下塗り層を被覆する。

内服用のために十分な回数のワニス被覆を行なう。

錠剤を完全に丸く且つ平滑にするために更に下塗り層及び平滑被覆が適用される。

所望の色合が得られるまで着色被覆を行なう。

乾燥後、被覆錠剤を磨いて均一な光沢の錠剤にする。

【0437】

製剤例 3

Passing No.10screen , you insert mixture in tray , 12 - 14 hoursdry with open of 100 deg C.

dried particle it mixes with No.16screen including sieve , drying sodium lauryl sulfate anddrying magnesium stearate , with pill making machine compresses in desired shape .

【0436】

Above-mentioned core is treated with varnish , talc is done dispersing , absorption of moisture vapor is prevented.

undercoating sheath is done in periphery of core .

varnish sheath of satisfactory number of times is done because for oral administration .

Completely to be round and furthermore undercoating and smooth sheath areapplied tablets in order to make smooth .

Until desired color texture is acquired, coloration sheath is done.

After drying, polishing coated tablet , it makes tablets of uniform gloss .

【0437】

Formulation Example 3

7-クロロ-5-[(4	-メチル-1		-ピペラジニル)カルボニル									
<seq>4 7-chloro - 5-	-methyl- 1		-piperazinyl) carbonyl									
メチル]-1-[2-メ	トキシ-4-		(2,	4-ジクロロベンジル								
<seq>2 - [me] </seq>methyl *- 1-	[tokishi] - 4 -		<seq>2,	4 -di chloro benzyl								
アミノ)ベンゾイル]	-	2, 3, 4	5-テ	トラヒドロ-1H-ベン								
amino) benzoyl *	-	2 and 3 and 4	5 - [te]	[torahidoro] - 1 H- [ben]								
ゾアゼピン												5 g
[zoazepin]												5 g
ポリエチレングリコール(分子量:4			000)								0. 3g
<seq>molecular weight :4 polyethylene glycol			000)								0.3 g
塩化ナトリウム												0. 9g
sodium chloride												0.9 g

sequential you washed organic layer with sodium bicarbonate-saturated water , 0.5Nhydrochloric acid ,

し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液: 酢酸エチル:n-ヘキサン=50:1~10:1)後、トルエン-n-ヘキサンで再結晶し、4-[(2-メチルベンゾイル)メチル]安息香酸メチルエステル15gを得た。

【0439】

参考例 2

4-メトキシカルボニルベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド 19.1g 及びナトリウムメチラート 2.77g をメタノール 20ml に懸濁し、室温で1時間攪拌した。

o-クロロベンズアルデヒド 5g を加え、室温で1時間攪拌後ナトリウムメチラート 5.54g を加え更に室温で1時間攪拌した。

反応混合物を濃縮後、残渣に水を加え酢酸エチルで抽出した。

有機相を、水、0.5N 塩酸、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。

残渣にジエチルエーテル-n-ヘキサンを加え不溶物を濾去した。

母液を濃縮後残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:n-ヘキサン:酢酸エチル=30:1)で精製した。

初めにメチル 4-(2-クロロステリル)ベンゾエート(シス体)が、続いてメチル 4-(2-クロロステリル)ベンゾエート(トランス体)が溶出してきた。

シス体は 2.15g、トランス体は 1.42g、いずれも白色粉末として得た。

【0440】

参考例 3

メチル 4-(2-クロロステリル)ベンゾエート(トランス体)1.42g、5N 水酸化ナトリウム 1.6ml 及びメタノール 20ml を室温で3時間、次いで2時間加熱還流した。

メタノールを減圧で留去し、残渣に水を加え、次いで濃塩酸で酸性にした。

室温で16時間攪拌後、析出晶を濾取すると4-(2-クロロステリル)安息香酸が白色粉末として1.36g得られた。

【0441】

参考例 4

saturated saline, after magnesium sulfate drying, concentrated, after silica gel column chromatography (eluate: ethylacetate:n-hexane=50:1~10:1), recrystallization did with toluene-n-hexane, 4-acquired { (2-methyl benzoyl) methyl } methyl benzoate ester 15g.

【0439】

Reference Example 2

4-methoxycarbonyl benzyl triphenyl phosphonium chloride 19.1g and suspension it designated sodium methylate 2.77g as methanol 20ml, 1 hour agitated with room temperature.

Including o-chloro benzaldehyde 5g, with room temperature furthermore 1 hour it agitated with room temperature including 1 hour after stirring sodium methylate 5.54g.

reaction mixture after concentrating, in residue was extracted with the ethylacetate including water.

sequential you washed organic phase, with water, and 0.5 Nhydrochloric acid, saturated saline after magnesium sulfate drying concentrated.

insoluble matter was filtered in residue including diethyl ether-n-hexane.

mother liquor after concentrating residue was refined with silica gel column chromatography (eluate:n-hexane:ethylacetate=30:1).

methyl 4-(2-chloro styryl) benzoate (cis isomer), continuously methyl 4-(2-chloro styryl) benzoate (trans isomer) liquated in beginning.

cis isomer 1.42 g, in each case acquired 2.15 g, trans isomer as white powder.

【0440】

Reference Example 3

methyl 4-(2-chloro styryl) benzoate (trans isomer) 1.42 g, 5N sodium hydroxide 1.6ml and methanol 20ml 3 hours, 2 hours heating and refluxing were done next with room temperature.

It removed methanol with vacuum, in residue with concentrated hydrochloric acid it made next acidity including water.

When 16 hour after stirring, precipitated crystal are filtered with room temperature, 4-(2-chloro styryl) benzoic acid 1.36 g it acquired as white powder.

【0441】

Reference Example 4

4-ブロモ安息香酸 7.2g 及びチオニルクロリド 20 ml を 1 時間加熱還流後濃縮し、次に残渣にトルエンを加えて再度濃縮した。

この 4-ブロモ安息香酸クロリドを 2-アミノ-2-メチル-1-プロパノール 5.1ml、トリエチルアミン 10ml 及びジクロロメタン 70ml の混合物中に、氷冷下滴下した。

反応混合物を室温で 5 時間攪拌後、氷を加えてジクロロメタン抽出した。

有機相を 0.5N-塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。

残渣をジクロロメタン 50ml に溶解し、氷冷下、チオニルクロリド 7.8ml を滴下した。

室温で 3 時間攪拌後氷冷にし、5N-水酸化ナトリウム水を徐々に加えてアルカリ性にした。

ジクロロメタン抽出し、有機層を水洗、硫酸マグネシウム乾燥すると、2-(4-ブロモフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリンが無色油状物として 8.3 g 得られた。

bp162-164 deg C/22mmHg.

【0442】

参考例 5

マグネシウム 526mg 及び乾燥テトラヒドロフラン 50ml を加熱還流下 2-(4-ブロモフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン 1g の乾燥テトラヒドロフラン(10ml)溶液に滴下した。

加熱を止め、ゆっくり還流する程度の速度で 2-(4-ブロモフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン 4g を滴下した。

その際 30 分攪拌後、氷冷にして o-トルアルデヒド 2.16ml を滴下した。

氷冷で 1 時間、室温で 2 時間攪拌後、飽和塩化アンモニウム水を加えて反応を中止し、酢酸エチル抽出した。

有機層を 1N-塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。

シリロゲルカラムクロマトグラフィー精製(溶出液:n-ヘキサン:酢酸エチル=4~2:1)により 2-{4-[1-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシメチル]フェニル}-4,4-ジメチル-2-オキサゾリンを白色粉末状として 3.07g 得た。

4-bromo benzoic acid 7.2g and 1 hour heating and refluxing later it concentrated thionyl chloride 20ml, next it concentrated for second time in residue including toluene.

this 4-bromo benzoic acid chloride 2-amino-2-methyl-1-propanol 5.1ml, triethylamine 10ml and under ice cooling was dripped in mixture of the dichloromethane 70ml.

reaction mixture dichloromethane was extracted with room temperature including 5 hours after stirring, ice.

sequential you washed organic phase with 0.5 N-hydrochloric acid, saturated aqueous sodium bicarbonate, saturated saline, after magnesium sulfate drying concentrated.

residue was melted in dichloromethane 50ml, under ice cooling, thionyl chloride 7.8ml was dripped.

With room temperature it made 3 hours after stirring ice cooling, added 5 N-sodium hydroxide water gradually and made the alkalinity.

When dichloromethane it extracts, water wash, magnesium sulfate drying does organic layer, 2-(4-bromophenyl)-4 and 4-dimethyl-2-oxazoline 8.35 g it acquired as colorless oil.

bp 162-164deg C/22mmHg.

[0442]

Reference Example 5

magnesium 526mg and dry tetrahydrofuran 50ml under 2 heating and refluxing - (4-bromophenyl) - 4 and 4-dimethyl-2-oxazoline 1g were dripped to dry tetrahydrofuran (10 ml) solution.

Heating was stopped, 2-(4-bromophenyl)-4 and 4-dimethyl-2-oxazoline 4g were dripped with the rate of extent reflux of doing slow.

At that occasion o-tolualdehyde 2.16ml was dripped to 30 minute after stirring, ice cooling.

With ice cooling it discontinued reaction with 1 hour, room temperature including 2 hours after stirring, saturated ammonium chloride water, ethyl acetate extraction did.

sequential you washed organic layer with 1 N-hydrochloric acid, saturated aqueous sodium bicarbonate, saturated saline, after magnesium sulfate drying concentrated.

3.07 g it acquired with [shirirogerukaramukuromatogurafii] refining (eluate ;n-hexane:ethylacetate =4~2:1) 2-{4-[1-(2-methylphenyl)-1-hydroxymethyl]phenyl}-4 and 4-dimethyl-2-oxazoline as white powder.

【0443】

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35(6H,s), 2.24(3H,s), 3.04(1H,d,J=4Hz), 4.08(1H,s), 5.99(1H,d,J=4Hz), 7.03-7.55(6H,m), 7.76-7.94(2H,m)。

【0444】

参考例 6

2-{4-[1-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシメチル]フェニル}-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン 3.0g、二酸化マンガン 20g 及びジクロロメタン 50ml を室温で混合し、室温で 2 時間、その後 3 時間加熱還流した。

不溶物をセライト濾過しクロロホルム洗浄した後、母液を濃縮すると淡黄色油状物として 2-[4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]-4,4-ジメチル-2-オキサゾリンを 2.86g 得た。

【0445】

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.40(6H,s), 2.33(3H,s), 4.14(2H,s), 7.12-7.54(4H,m), 7.76-7.92(2H,m), 7.95-8.14(2H,m)。

【0446】

参考例 7

2-[4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン 2.86g 及び 4.5M 塩酸 150ml を 8 時間加熱還流した。

室温まで冷却し、水を加えて析出物を濾取すると 4-(2-メチルベンゾイル)安息香酸が白色粉末として 2.23g 得られた。

【0447】

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.37(3H,s), 7.19-7.58(4H,m), 7.80-8.03(2H,m), 8.10-8.35(2H,m), 10.4(1H,brs)。

【0448】

参考例 8

アルゴン気流下、3-メトキシ-4-トリフルオロメチルスルホニルオキシ安息香酸メチルエステル 5g のトルエン 200ml 溶液へ、テトラキス(トリフェニルフォスフィン)パラジウム 0.9g を加え、室温にて 5 分攪拌した。

そこへ、(2-メチルフェニル)ホウ酸 3.2g、リチウムクロリド 1.01g 及び 2M 炭酸ナトリウム水溶液 11.9ml を加え、100 deg C にて 2 時間攪拌した。

水を加え、パラジウムをセライト濾別し、濾液を

【0443】

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;de ppm :1.35 (6 H, s) , 2.24 (3 H, s) , 3.04 (1 H, d, J=4Hz) , 4.08 (1 H, s) , 5.99 (1 H, d, J=4Hz) , 7.03 - 7.55(6 H, m) , 7.76 - 7.94 (2 H, m) .

【0444】

Reference Example 6

2 - { 4 - { 1 - (2 -methylphenyl) - 1 -hydroxymethyl } phenyl } - 4 and 4 -dimethyl -2- oxazoline 3.0g, manganese dioxide 20g and it mixed dichloromethane 50ml with room temperature , 2 hours , after that 3 hours heating and refluxing did with room temperature .

When insoluble matter is done celite filtration and chloroform after washing, the mother liquor is concentrated, 2 - { 4 - (2 -methyl benzoyl) phenyl } - 4 and 4 -dimethyl -2- oxazoline 2.86 g wereacquired as pale yellow oil .

【0445】

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;de ppm :1.40 (6 H, s) , 2.33 (3 H, s) , 4.14 (2 H, s) , 7.12 - 7.54 (4 H, m) , 7.76 - 7.92(2 H, m) , 7.95 - 8.14 (2 H, m) .

【0446】

Reference Example 7

2 - { 4 - (2 -methyl benzoyl) phenyl } - 4 and 4 -dimethyl -2- oxazoline 2.86g and 4.5 Mhydrochloric acid 150ml were done 8 -hour heating and refluxing .

When it cools to room temperature , it filters precipitate including water,4 - (2 -methyl benzoyl) benzoic acid 2.23 g it acquired as white powder .

【0447】

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;de ppm :2.37 (3 H, s) , 7.19 - 7.58 (4 H, m) , 7.80 - 8.03 (2 H, m) , 8.10 - 8.35 (2 H, m) ,10.4 (1 H, brs) .

【0448】

Reference Example 8

Under argon stream , 3 -methoxy -4- trifluoromethyl sulfonyloxy methyl benzoate ester 5g to toluene 200ml solution , including tetrakis (triphenyl phosphine) palladium 0.9g,5 min it agitated with room temperature .

To there, including (2 -methylphenyl) boric acid 3.2g, lithium chloride 1.01g and 2 Msodium carbonate aqueous solution 11.9ml , 2 hours it agitated with100 deg C.

Including water, palladium was filtered celite , filtrate

ジエチルエーテルにて抽出した。

エーテル層を水洗乾燥後、減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;n-ヘキサン→酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10)に付し、4.07gの3-メトキシ-4-(2-メチルフェニル)安息香酸メチルエステルを油状物として得た。

【0449】

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.12(3H,s), 3.82(3H,s), 3.95(3H,s), 7.02~7.48(5H,m), 7.63(1H,d,J=1.51Hz), 7.71(1H,dd,J=1.5Hz,7.74Hz)。

【0450】

適当な出発原料を用い、参考例8と同様にして後記実施例22、23及び35~64の化合物を得た。

【0451】

参考例9

アルゴン雰囲気下、2-(4-フェニル-2-メトキシフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン3.00gをテトラヒドロフラン30mlに溶解後、氷浴上にて冷却撹拌した。

同温度にて約2モル/l-n-プロピルマグネシウムブロミド-テトラヒドロフラン溶液8.0mlを徐々に滴下した。

滴下終了後、室温に戻し16時間撹拌した。

反応液を再度氷浴上にて冷却撹拌下、飽和塩化アンモニウム水溶液30mlを加え、室温に戻した後、有機層を分取した。

更に、水層より酢酸エチルで抽出(30ml×2)した。

有機層を合わせ、飽和食塩水洗浄(100ml×2)後、硫酸マグネシウム上で乾燥した。

溶媒を減圧留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:n-ヘキサン=1:2→1:1)にて精製し、溶媒を減圧留去後、2-(4-フェニル-2-n-プロピルフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリンを無色透明粘稠油として、2.81g得た。

【0452】

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.98(3H,t,J=11.3Hz), 1.39(6H,s), 1.52-1.77(2H,m), 2.99(2H,dd,J=7.5Hz,J=9.5Hz), 4.08(2H,s), 7.30-7.51(5H,

was extracted with diethyl ether.

After water wash drying, vacuum distillation it did ether layer, attached on silica gel column chromatography (eluate;n-hexane*ethylacetate:n-hexane=1:10), it acquired 3-methoxy-4-(2-methylphenyl)methyl benzoate ester of 4.07 g as oil.

【0449】

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); δ ppm:2.12 (3 H, s), 3.82 (3 H, s), 3.95 (3 H, s), 7.02 - 7.48 (5 H, m), 7.63 (1 H, d, J=1.51 Hz), 7.71 (1 H, dd, J=1.5 Hz, 7.74 Hz).

【0450】

Postscript Working Example 2 2, 2 3 and compound 35 - 64 was acquired making use of the suitable starting material, to similar to Reference Example 8.

【0451】

Reference Example 9

Under argon atmosphere, 2-(4-phenyl-2-methoxyphenyl)-[tetrahydrofuran] in 30 ml it cooled agitated 4 and 4-dimethyl-2-oxazoline 3.00g after melting and on ice bath.

Approximately 2 mole/liter -n-propyl magnesium bromide-tetrahydrofuran solution 8.0ml were dripped gradually with same temperature.

After end of dropping addition, you reset to room temperature and 16 hours agitated.

reaction mixture for second time under cooling agitating, after resetting to room temperature including saturated ammonium chloride aqueous solution 30ml, organic layer fraction collection was done on the ice bath.

Furthermore, from water layer it extracted (30 ml X 2) with ethylacetate.

It adjusted organic layer, dried after saturated saline washing (100 ml X 2) and on the magnesium sulfate.

solvent after vacuum distillation, residue was refined with silica gel column chromatography (eluate;dichloromethane:n-hexane=1:2*1:1), solvent 2.81 g was acquired after vacuum distillation, 2-(4-phenyl-2-n-propyl phenyl)-4 and 4-dimethyl-2-oxazoline as colorless and transparent viscous oil.

【0452】

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); δ ppm:0.98 (3 H, t, J=11.3 Hz), 1.39 (6 H, s), 1.52 - 1.77 (2 H, m), 2.99 (2 H, dd, J=7.5 Hz, J=9.5 Hz), 4.08 (2 H, s), 7.30-

m), 7.52-7.63(2H,m), 7.78(1H,d,J=6.5Hz)。

[0453]

参考例 10

濃塩酸 30ml 及び氷酢酸 10ml の混合液に 2-(4-フェニル-2-n-プロピルフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン 2.70g を加え、3 日間(9 時間×3) 加熱還流した。

反応液を約 2 分の 1 に減圧濃縮後、氷浴上冷却した。

析出晶を濾取し、この析出晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー精製(溶出液;ジクロロメタン→ジクロロメタン:メタノール=50:1)し、溶媒を減圧留去後、残渣結晶を n-ヘキサンにて再結晶し、4-フェニル-2-n-プロピル安息香酸を無色針状として、1.67g 得た。

[0454]

mp107.5~108.5 deg C。

[0455]

参考例 11

2-(4-ブromo-2-メチルフェニル)-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン 5g の乾燥テトラヒドロフラン 40ml 溶液に、-70 deg C にて、1.6Mn-ブチルリチウム 1 4.0ml の n-ヘキサン溶液を滴下した。

同温度で 30 分攪拌後、シクロヘキサノン 2.1ml を滴下し、そのまま 1 時間攪拌した。

水を加え、テトラヒドロフランを減圧留去した後、ジエチルエーテルにて抽出した。

ジエチルエーテル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=100:1→60:1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにて再結晶し、2-[4-(1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシル)-2-メチルフェニル]-4,4-ジメチル-2-オキサゾリンを 4.29g 得た。

[0456]

白色粉末状

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-1.98(11H, m), 1.38(6H,s), 2.57(3H,s), 4.05(2H,s), 7.19-7.45(2H,m), 7.72(1H,d,J=8.1Hz)。

[0457]

参考例 12

2-[4-(1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシル)-2-メチルフェニル]-4,4-ジメチル-2-オキサゾリン 4.29g の酢

7.51 (5 H, m), 7.52 - 7.63 (2 H, m), 7.78 (1 H, d, J=6.5Hz) .

[0453]

Reference Example 10

3 -day period (9 hours X 3) heating and refluxing it made mixed solution of concentrated hydrochloric acid 30ml and glacial acetic acid 10ml 2 -(4 -phenyl -2- n- propyl phenyl) - including 4 and 4 -dimethyl -2- oxazoline 2.70g .

reaction mixture after vacuum concentration and on ice bath was cooled in approximately 1/2 .

It filtered precipitated crystal , silica gel column chromatography refining (eluate ;dichloromethane *dichloromethane :methanol =50:1) did this precipitated crystal , after the vacuum distillation , residue crystal recrystallization did solvent with n- hexane , 1.67 g itacquired 4 -phenyl -2- n- propyl benzoic acid as colorless needle .

[0454]

mp107.5~108.5deg C.

[0455]

Reference Example 11

2 - (4 -bromo -2- methylphenyl) - 4 and 4 -dimethyl -2- oxazoline 5g in dry tetrahydrofuran 40ml solution , - with 70 deg C, n- hexane solution of 1.6 Mn -butyl lithium 14.0ml was dripped .

After 30 minutes agitating, it dripped cyclohexanone 2.1ml with same temperature , 1 hour agitated that way .

Including water, after vacuum distillation doing tetrahydrofuran , it extracted with diethyl ether .

diethyl ether layer after drying, vacuum distillation it did solvent with anhydrous magnesium sulfate , the residue it attached on silica gel column chromatography (eluate ;dichloromethane :methanol =100:1*60:1), recrystallization did with acetone -n- hexane , 2 -{4 - (1 -hydroxy -1- cyclohexyl) - 2 -methylphenyl } - 4.29 g . acquired 4 and 4 -dimethyl -2- oxazoline .

[0456]

white powder

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ; δ ppm :1.14-1.98 (11 H, m), 1.38 (6 H, s), 2.57 (3 H, s), 4.05 (2 H, s), 7.19 - 7.45 (2 H, m), 7.72(1 H, d, J=8.1Hz) .

[0457]

Reference Example 12

2 - {4 - (1 -hydroxy -1- cyclohexyl) - 2 -methylphenyl } - 4,4 -dimethyl -2- oxazoline 4.29g 2 day reflux it made acetic acid

酸 40ml 溶液に 10%塩酸 20ml を加え、2 日間還流した。

析出する結晶を濾取し、水洗、乾燥後、4-シクロヘキセニル-2-メチル安息香酸を 2.61g 得た。

【0458】

白色粉末状

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.55-1.93(4H, m), 2.13-2.31 及び 2.32-2.56(各 2H,各 m), 2.66 (3H,s), 6.17-6.34(1H,m), 7.15-7.42(2H,m), 7.9 0-8.18(1H,m)。

【0459】

参考例 13

4-シクロヘキセニル-2-メチル安息香酸 2.61g のエタノール 30ml 及び酢酸エチル 30ml 溶液に 5%パラジウム-炭素 0.4g を加え、水素雰囲気下、常温常圧下 30 分撹拌した。

パラジウム-炭素をセライト濾別し、濾液の溶媒を減圧留去後、結晶を濾取し、アセトン-n-ヘキサンにて結晶化し、洗浄して、2.27g の 4-シクロヘキシル-2-メチル安息香酸を得た。

【0460】

白色粉末状

mp129~130 deg C。

【0461】

参考例 14

N-メチルピペリドン 5ml に 4-フェニルピペリンジン 0.5g、p-フルオロベンゾニトリル 0.37g 及び炭酸カリウム 0.78g を溶解し、120 deg C で 5 時間撹拌した。

反応液に酢酸エチル 50ml を加え、精製水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥後濾過し、減圧下濃縮した。

得られた残渣にメタノールを加え、不溶結晶を濾取し、減圧下で乾燥して 4-フェニル-1-(4-シアノフェニル)ピペリンジン 0.39g を、白色針状として得た。

【0462】

mp167~169 deg C。

【0463】

参考例 15

40ml solution including 10% hydrochloric acid 20ml .

crystal which it precipitates was filtered, after water wash , drying, 4-cyclohexenyl -2- methyl benzoic acid 2.61 g were acquired.

【0458】

white powder

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.55-1.93 (4 H, m) , 2.13 - 2.31 and 2.32 - 2.56 (Each 2 H, each m) , 2.66 (3 H, s) , 6.17 -6.34 (1 H, m) , 7.15 - 7.42 (2 H, m) , 7.90 - 8.18 (1 H, m) .

【0459】

Reference Example 13

4 -cyclohexenyl -2- methyl benzoic acid 2.61g under hydrogen atmosphere , ambient temperature ambient pressure lower 30 minutes it agitated in the ethanol 30ml and ethylacetate 30ml solution including 5% palladium -carbon 0.4g.

celite it filtered palladium -carbon , solvent of filtrate after the vacuum distillation , it filtered crystal , crystallization did with acetone -n- hexane , washed,2.27 g acquired 4 -cyclohexyl -2- methyl benzoic acid .

【0460】

white powder

mp129~130deg C.

【0461】

Reference Example 14

4 - [fenirupiperinjin] it melted 0.5 g, p- fluorobenzonitrile 0.37g and potassium carbonate 0.78g in N- methyl piperidone 5ml , 5 hours agitated with 120 deg C.

You washed after drying you filtered due to magnesium sulfate , in reaction mixture including ethylacetate 50ml , with purified water , under vacuum concentrated.

It filtered insoluble crystal dried under vacuum and it acquired in the residue which it acquires including methanol , (4 -cyanophenyl) piperidine 0.39g, 4 -phenyl -1- as white needle .

【0462】

mp167~169deg C.

【0463】

Reference Example 15

4-フェニル-1-(4-シアノフェニル)ピペリジン 0.39g に酢酸 10ml 及び濃塩酸 10ml を加えて 5 時間還流した。

反応液を濃縮し、残渣にジエチルエーテル-メタノールを加え不溶結晶を濾取し、減圧下で乾燥して 4-フェニル-1-(4-カルボキシフェニル)ピペリジン 0.39g を、白色粉末状として得た。

【0464】

mp257~259 deg C(分解)。

【0465】

参考例 16

ホモピペラジン 100g をエタノール 500ml に溶かし、沃化エチル 19.8ml を徐々に滴下した。

室温で一晩攪拌した後、不溶物を濾過して除去した。

溶媒を減圧下に除去した後、蒸留により精製し、1-エチルホモピペラジン 50g を得た。

【0466】

無色油状

bp86~88 deg C/37mmHg

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.06(3H,t,J=7.2Hz), 1.68-1.93(2H,m), 2.54(2H,q,J=7.2Hz), 2.63-2.76(7H,m), 2.87-3.01(2H,m)。

【0467】

参考例 17

4-フェニル-2-クロロ-1-トリフルオロメチルスルホニルオキシベンゼン 35g のジメチルホルムアミド 300ml 溶液に、一酸化炭素雰囲気下、酢酸パラジウム 1.17g、1,3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン 4.29g、エタノール 91.5ml 及びトリエチルアミン 29.0ml を加え、80~90 deg C で 6 時間加熱攪拌した。

反応液に水を加えて n-ヘキサンを少量加えて酢酸エチルにて抽出した。

酢酸エチル層を水洗乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:n-ヘキサン→酢酸エチル:n-ヘキサン=1:100)に付し、4-フェニル-2-クロロ安息香酸エチルを 20.9g、無色油状物として得た。

【0468】

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.42(3H,t,J=7.0Hz), 4.42(2H,q,J=7.0Hz), 7.28-7.78 及び 7.85-8.18(全 8H,m)。

4-phenyl -1- 5 hours reflux it made (4 -cyanophenyl) piperidine 0.39g including acetic acid 10ml and the concentrated hydrochloric acid 10ml .

It concentrated reaction mixture , it filtered insoluble crystal in residue including diethyl ether -methanol , dried under vacuum and it acquired (4 -carboxy phenyl) piperidine 0.39g, 4 -phenyl -1- as white powder .

【0464】

mp257~259deg C (Disassembly).

【0465】

Reference Example 16

homo piperazine 100g was melted in ethanol 500ml , ethyl iodide 19.8ml was dripped gradually.

overnight after agitating, filtering insoluble matter with room temperature , it removed.

After removing solvent under vacuum , it refined with distillation, acquired 1 -ethyl homo piperazine 50g.

【0466】

colorless oily

bp 86~88deg C/37mmHg

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ; δ ppm :1.06 (3 H, t, J=7.2Hz), 1.68 - 1.93 (2 H, m), 2.54 (2 H, q, J=7.2Hz), 2.63 - 2.76 (7 H, m), 2.87 -3.01 (2 H, m).

【0467】

Reference Example 17

4 -phenyl -2- chloro -1- trifluoromethyl sulfonyloxy benzene 35g in dimethylformamide 300ml solution , 6 hours heat and stir it did with 80 - 90 deg C under the carbon monoxide atmosphere , including palladium acetate 1.17g, 1,3- bis (diphenylphosphino) propane 4.29g, ethanol 91.5ml and triethylamine 29.0ml .

trace adding n- hexane to reaction mixture including water, it extracted with ethylacetate .

ethyl acetate layer after water wash drying, residue it attached on silica gel column chromatography (eluate :n- hexane *ethylacetate :n- hexane =1:100),it acquired 4 -phenyl -2- chloro ethyl benzoate as 20.9 g, colorless oil .

【0468】

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ; δ ppm :1.42 (3 H, t, J=7.0Hz), 4.42 (2 H, q, J=7.0Hz), 7.28 - 7.78 and 7.85 - 8.18 (All 8 H, m).

JP1997221476A

1997-8-26

【0469】

適当な出発原料を用い、前記参考例 17 と同様に下記化合物を得た。

【0470】

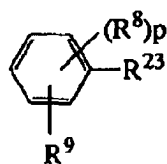
【表 1】

[0469]

Making use of suitable starting material , being similar to aforementioned Reference Example 17, itacquired below-mentioned compound .

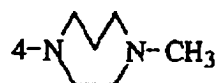
[0470]

[Table 1]



参考例 18

構造

R⁹ :

p : 1

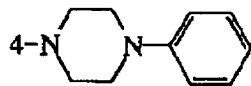
R⁸ : 2-ClR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 褐色油状

形態 : 遊離

参考例 19

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-ClR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 褐色油状

形態 : 遊離

【0471】

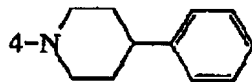
[0471]

【表 2】

[Table 2]

参考例 20

構造

R⁹ :

p : 1

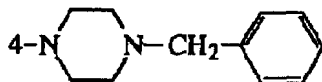
R⁸ : 2-ClR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 21

構造

R⁹ :

p : 1

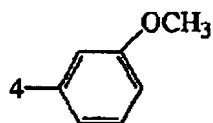
R⁸ : 2-ClR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 黄色油状

形態 : 遊離

参考例 22

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0472】

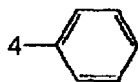
[0472]

【表 3】

[Table 3]

参考例 23

構造

R⁹ :

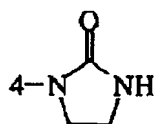
p : 1

R⁸ : 2-NO₂R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 黄色粘稠油
形態 : 遊離

参考例 24

構造

R⁹ :

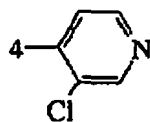
p : 1

R⁸ : 2-ClR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 25

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色固体
形態 : 遊離

【0473】

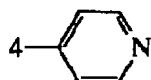
[0473]

【表 4】

[Table 4]

参考例 26

構造

R⁹ :

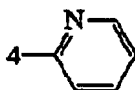
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

参考例 27

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 96 - 98℃
形態 : 遊離

【0474】

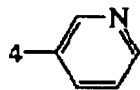
[0474]

【表 5】

[Table 5]

参考例 28

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状

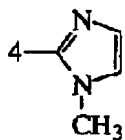
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 100 - 102℃

形態 : 遊離

参考例 29

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 126 - 128℃

形態 : 遊離

【0475】

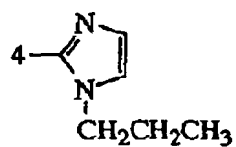
【表 6】

【0475】

【Table 6】

参考例 30

構造

R⁹ :

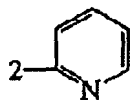
p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 褐色油状
形態 : 遊離

参考例 31

構造

R⁹ :

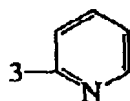
p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡褐色油状
形態 : 遊離

参考例 32

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0476】

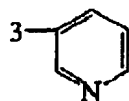
[0476]

【表 7】

[Table 7]

参考例 33

構造

R⁹ :

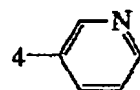
p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

参考例 34

構造

R⁹ :

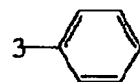
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 褐色油状
形態 : 遊離

参考例 35

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0477】

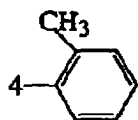
[0477]

【表 8】

[Table 8]

参考例 36

構造

R⁹ :

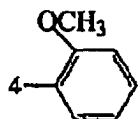
p : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 微黄色油状
形態 : 遊離

参考例 37

構造

R⁹ :

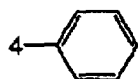
p : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 38

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0478】

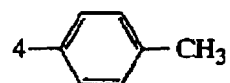
[0478]

【表 9】

[Table 9]

参考例 39

構造

R⁹ :

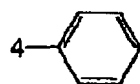
p : 2

R⁸ : 3,5-di-OCH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色プリズム状
形態 : 遊離

参考例 40

構造

R⁹ :

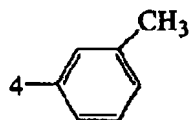
p : 1

R⁸ : 3-OCH₃R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 41

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : HR²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0479】

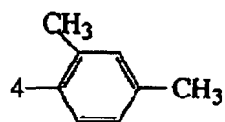
[0479]

【表 10】

[Table 10]

参考例 42

構造

R⁹ :

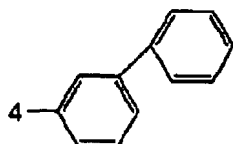
P : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 43

構造

R⁹ :

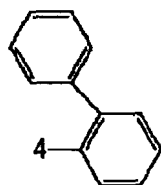
P : 1

R⁸ : HR²³ : -CO₂C₂H₅

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 44

構造

R⁹ :

P : 1

R⁸ : HR²³ : -CO₂C₂H₅

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0480】

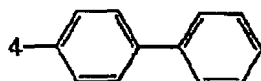
[0480]

【表 11】

[Table 11]

参考例 45

構造

R⁹ :

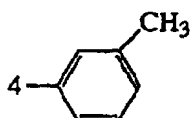
p : 1

R⁸ : HR²³ : $-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 46

構造

R⁹ :

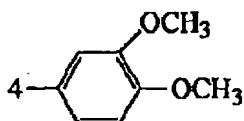
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : $-\text{CO}_2\text{CH}_3$

結晶形 : 微黄色油状
形態 : 遊離

参考例 47

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : $-\text{CO}_2\text{CH}_3$

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0481】

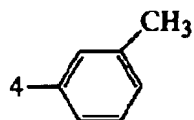
{0481}

【表 12】

[Table 12]

参考例 48

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 49

構造

R⁹ :

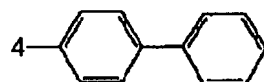
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 50

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0482】

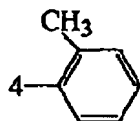
[0482]

【表 13】

[Table 13]

参考例 51

構造

R⁹ :

p : 1

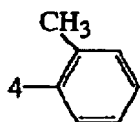
R⁸ : 3-OCH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

参考例 52

構造

R⁹ :

p : 2

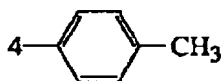
R⁸ : 3,5-di-OCH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 53

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色プリズム状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0483】

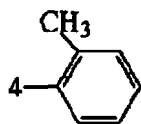
[0483]

【表 14】

[Table 14]

参考例 54

構造

R⁹ :

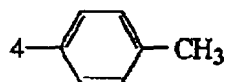
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 55

構造

R⁹ :

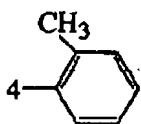
p : 1

R⁸ : HR²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 56

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : HR²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0484】

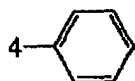
[0484]

【表 15】

[Table 15]

参考例 57

構造

R⁹ :

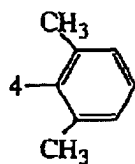
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色プリズム状
形態 : 遊離

参考例 58

構造

R⁹ :

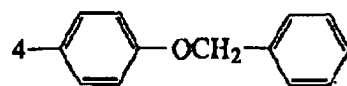
p : 1

R⁸ : 2-OCH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 59

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0485】

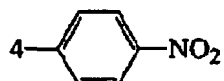
[0485]

【表 16】

[Table 16]

参考例 60

構造

R⁹ :

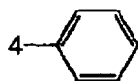
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 微黄色粉末状
形態 : 遊離

参考例 61

構造

R⁹ :

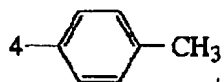
p : 1

R⁸ : 2-ClR²³ : -CO₂C₂H₅

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 62

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 微黄色粉末状
形態 : 遊離

【0486】

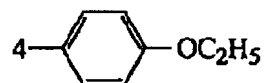
[0486]

【表 17】

[Table 17]

参考例 63

構造

R⁹ :

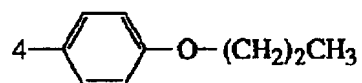
p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 64

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

【0487】

[0487]

適当な出発原料を用い、前記参考例 3、7、10 又は 12 と同様にして下記の化合物を得た。

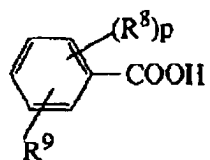
Below-mentioned compound was acquired making use of suitable starting material, to similar to aforementioned Reference Example 3, 7, 10 or 12.

【0488】

[0488]

【表 18】

[Table 18]



参考例 65

構造

R⁹ :

p : 1

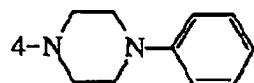
R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 66

構造

R⁹ :

p : 1

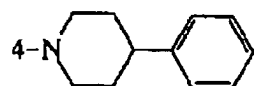
R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

参考例 67

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0489】

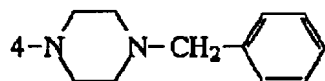
[0489]

【表 19】

[Table 19]

参考例 68

構造

R⁹ :

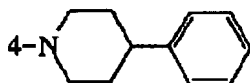
p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 69

構造

R⁹ :

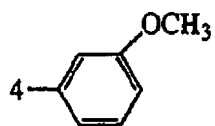
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 257 - 259℃ (分解)
形態 : 遊離

参考例 70

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0490】

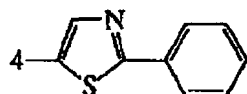
[0490]

【表 20】

[Table 20]

参考例 71

構造

R⁹ :

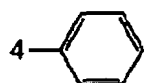
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 褐色粉末状
形態 : 遊離
融点 : 233 - 235℃

参考例 72

構造

R⁹ :

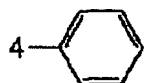
p : 1

R⁸ : 2-C₂H₅

結晶形 : 無色板状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-クロロホルム
融点 : 164 - 165℃
形態 : 遊離

参考例 73

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-n-C₃H₇

結晶形 : 無色針状
結晶溶媒 : n-ヘキサン
融点 : 107.5 - 108.5℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0491】

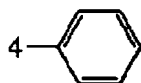
[0491]

【表 21】

[Table 21]

参考例 74

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-NO₂

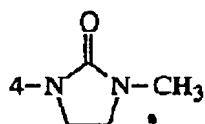
結晶形 : 赤褐色粉末状

融点 : 199 - 201℃

形態 : 遊離

参考例 75

構造

R⁹ :

p : 1

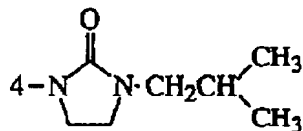
R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 76

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0492】

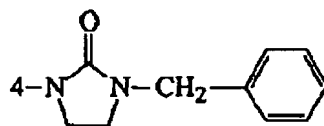
[0492]

【表 22】

[Table 22]

参考例 77

構造

R⁹ :

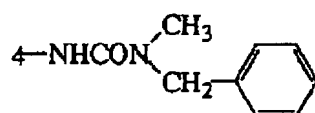
p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 微赤色粉末状
形態 : 遊離

参考例 78

構造

R⁹ :

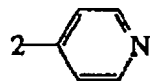
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 79

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0493】

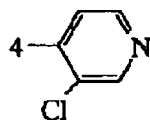
[0493]

【表 23】

[Table 23]

参考例 80

構造

R⁹ :

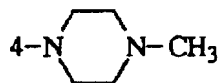
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : HCl

参考例 81

構造

R⁹ :

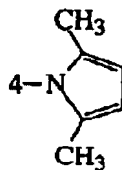
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 褐色粉末状
形態 : 遊離

参考例 82

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 淡褐色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 133 - 135℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0494】

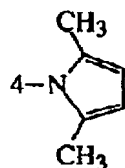
[0494]

【表 24】

[Table 24]

参考例 83

構造

R⁹ :

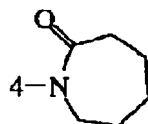
p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 褐色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 126 - 128℃
形態 : 遊離

参考例 84

構造

R⁹ :

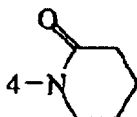
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 198 - 201℃
形態 : 遊離

参考例 85

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 236 - 239℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0495】

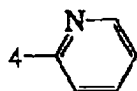
[0495]

【表 25】

[Table 25]

参考例 86

構造

R⁹ :

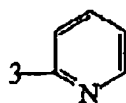
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色針状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 257 - 260℃
形態 : 遊離

参考例 87

構造

R⁹ :

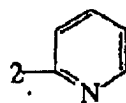
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 淡褐色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 201 - 203℃
形態 : 遊離

参考例 88

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 230℃ (分解)
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0496】

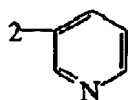
[0496]

【表 26】

[Table 26]

参考例 89

構造

R⁹ :

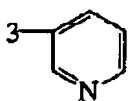
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 206 - 207℃
形態 : HCl

参考例 90

構造

R⁹ :

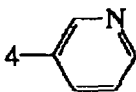
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 266 - 269℃
形態 : HCl

参考例 91

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール
融点 : 276 - 279℃
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0497】

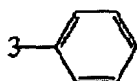
[0497]

【表 27】

[Table 27]

参考例 92

構造

R⁹ :

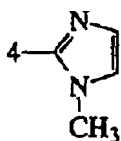
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 161 - 163℃
形態 : 遊離

参考例 93

構造

R⁹ :

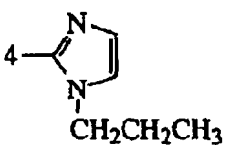
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 250 - 251℃
形態 : 遊離

参考例 94

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0498】

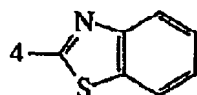
[0498]

【表 28】

[Table 28]

参考例 95

構造

R⁹ :

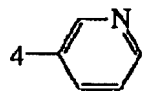
P : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色針状
形態 : 遊離

参考例 96

構造

R⁹ :

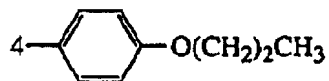
P : 1

R⁸ : H

結晶形 : 淡黄色針状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 309 - 311℃
形態 : HCl

参考例 97

構造

R⁹ :

P : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 198 - 200℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0499】

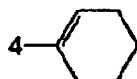
[0499]

【表 29】

[Table 29]

参考例 98

構造

R⁹ :

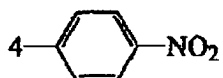
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 99

構造

R⁹ :

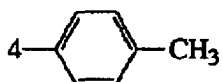
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 100

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 208℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0500】

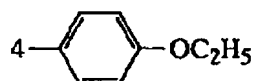
[0500]

【表 30】

[Table 30]

参考例 101

構造

R⁹ :

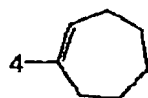
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 234 - 236℃
形態 : 遊離

参考例 102

構造

R⁹ :

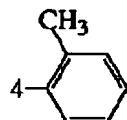
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 103

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 132 - 133℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0501】

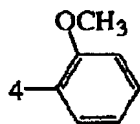
[0501]

【表 31】

[Table 31]

参考例 104

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 無色プリズム状

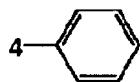
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 153 - 154℃

形態 : 遊離

参考例 105

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 無色プリズム状

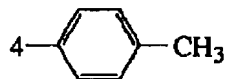
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 118 - 119℃

形態 : 遊離

参考例 106

構造

R⁹ :

p : 2

R⁸ : 3,5-di-OCH₃

再結晶溶媒 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 239 - 240℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0502】

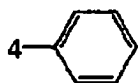
[0502]

【表 32】

[Table 32]

参考例 107

構造

R⁹ :

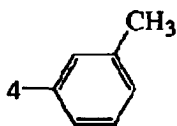
p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 179 - 182℃
形態 : 遊離

参考例 108

構造

R⁹ :

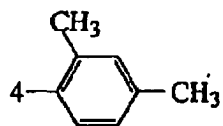
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 194 - 197℃
形態 : 遊離

参考例 109

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 149 - 150℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0503】

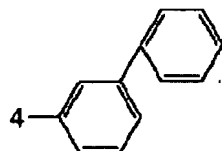
[0503]

【表 33】

[Table 33]

参考例 110

構造

R⁹ :

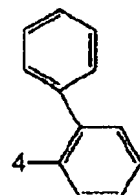
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 202 - 204℃
形態 : 遊離

参考例 111

構造

R⁹ :

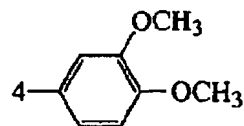
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 112

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 134 - 135℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0504】

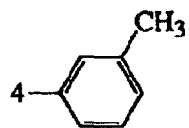
[0504]

【表 34】

[Table 34]

参考例 113

構造

R⁹ :

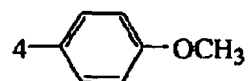
p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 114

構造

R⁹ :

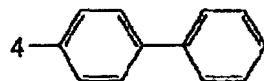
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 115

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 262 - 265℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0505】

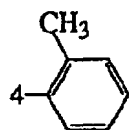
[0505]

【表 35】

[Table 35]

参考例 116

構造

R⁹ :

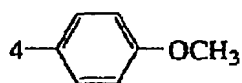
p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 117

構造

R⁹ :

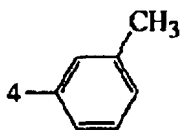
p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 146 - 147℃
形態 : 遊離

参考例 118

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

再結晶溶媒 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 132 - 133℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0506】

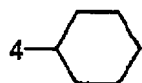
[0506]

【表 36】

[Table 36]

参考例 119

構造

R⁹ :

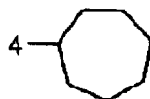
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 129 - 130℃
形態 : 遊離

参考例 120

構造

R⁹ :

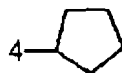
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 121

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0507】

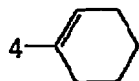
[0507]

【表 37】

[Table 37]

参考例 122

構造

R⁹ :

p :

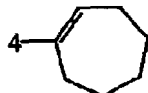
1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 123

構造

R⁹ :

p :

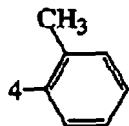
1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 124

構造

R⁹ :

p :

2

R⁸ : 3,5-di-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 231 - 232℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0508】

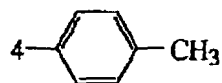
[0508]

【表 38】

[Table 38]

参考例 125

構造

R⁹ :

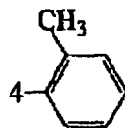
p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 159 - 160℃
形態 : 遊離

参考例 126

構造

R⁹ :

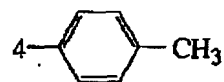
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 117 - 118℃
形態 : 遊離

参考例 127

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 246 - 248℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0509】

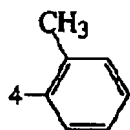
[0509]

【表 39】

[Table 39]

参考例 128

構造

R⁹ :

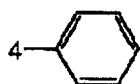
p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 185 - 187℃
形態 : 遊離

参考例 129

構造

R⁹ :

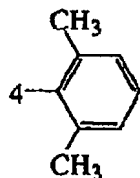
p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 130

構造

R⁹ :

p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

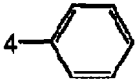
再結晶溶媒 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 145 - 148℃
形態 : 遊離

【0510】

[0510]

【表 40】

[Table 40]

参考例	131
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ⁸ :	2-Cl
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	アセトン-n-ヘキサン
融点 :	164℃
形態 :	遊離

【0511】

[0511]

適当な出発原料を用い、前記参考例 17 と同様にして下記の化合物を得た。

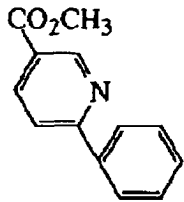
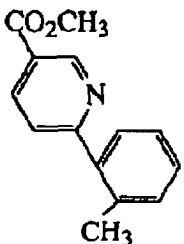
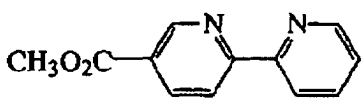
Below-mentioned compound was acquired making use of suitable starting material , tosimilar to aforementioned Reference Example 17.

【0512】

[0512]

【表 41】

[Table 41]

参考例	化合物 (形態)	物性
132	 (遊離)	白色針状 ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 200MHz) δppm: 3.97 (3H, s), 7.48-7.62 (3H, m), 7.81 (1H, dd, J=8.0Hz, J=0.8Hz), 7.98-8.17 (2H, m), 8.34 (1H, dd, J=8.0Hz, J=2.2Hz), 9.28 (1H, dd, J=2.2Hz, 0.8Hz).
133	 (遊離)	白色粉末状 ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 200MHz) δppm: 2.38 (3H, s), 3.98 (3H, s), 7.19-7.50 (4H, m), 7.50 (1H, dd, J=0.8Hz, J=8.0Hz), 8.35 (1H, dd, J=8.0Hz, J=2.0Hz), 9.30 (1H, dd, J=0.8Hz, 2.0Hz)
134	 (遊離)	淡褐色粉末状 融点: 110 - 111℃ 再結晶溶媒: クロロホルム-ジエチルエーテル

【0513】

適当な出発原料を用い、前記参考例3、7、10又は12と同様にして下記の化合物を得た。

【0514】

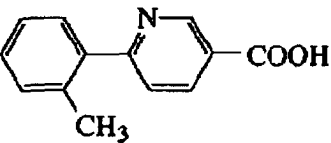
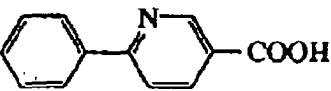
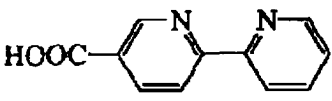
【表 42】

【0513】

Below-mentioned compound was acquired making use of suitable starting material, to similar to aforementioned Reference Example 3, 7, 10 or 12.

【0514】

[Table 42]

参考例	化合物 (形態)	物性
135	 (遊離)	無色針状 融点: 191 - 192℃
136	 (遊離)	無色針状 融点: 228 - 230℃
137	 (HCl)	淡褐色針状 融点: 253 - 255℃ 再結晶溶媒: メタノール-ジエチルエーテル

【0515】

適当な出発原料を用い、前記参考例 17 と同様にして下記の化合物を得た。

【0516】

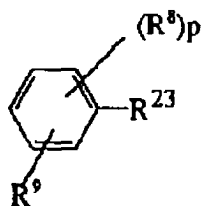
【表 43】

【0515】

Below-mentioned compound was acquired making use of suitable starting material, to similar to aforementioned Reference Example 17.

【0516】

[Table 43]



参考例	R^8	p	R^9	R^{23}
138	H	1	4-substituted indazole	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$
139	H	1	4-substituted 6-methylindazole	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$
140	H	1	4-(chloroacetyl)aniline	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$
141	2- CH_3	1	4-(chloroacetyl)aniline	$-\text{CO}_2\text{CH}_3$

【0586】

参考例 77

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz,DMSO- d_6) δ ppm:3.3-3.41(2 H,m), 3.75-3.95(2H,m), 4.39(2H,s), 7.2-7.45(5 H,m), 7.5(1H,dd,J=9Hz,J=2.2Hz), 7.84(1H,d,J=9Hz), 7.88(1H,d,J=2.2Hz)。

【0639】

実施例 1

4-エトキシ-2-メキシ安息香酸 0.33g を塩化チオニル 10ml に溶かし、30 分間加熱還流した。

このものを減圧下に濃縮後、トルエン 20ml を加えて再び減圧下濃縮した。

得られた 4-エトキシ-2-メキシベンゾイルクロリドをジクロロメタン 10ml に溶かした後、氷浴上で

【0586】

Reference Example 77

$^1\text{H-nmr}$ (200 MHz , DMSO- d_6) ; δ ppm :3.3- 3.41 (2 H, m), 3.75 - 3.95 (2 H, m), 4.39 (2 H, s), 7.2 - 7.45 (5 H, m), 7.5 (1 H, dd, J=9Hz , J=2.2Hz),7.84 (1 H, d, J=9Hz), 7.88 (1 H, d, J=2.2Hz).

【0639】

Working Example 1

It melted 4 -ethoxy -2- methoxy benzoic acid 0.33g in thionyl chloride 10ml , 30 minute heating and refluxing did.

Again this after concentrating, under vacuum it concentrated under vacuum including toluene 20ml .

4 -ethoxy -2- methoxy benzoyl chloride where it acquires after melting in dichloromethane 10ml , on ice bath were

0 deg C に冷却し、7-クロロ-5-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノ]カルボニルメチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.5g を加えた。

続いて、トリエチルアミン 0.6ml を加え、そのままの温度で 2 時間攪拌した。

反応物に水を加えてジクロロメタンにて抽出後、炭酸ナトリウムにて乾燥した。

シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=50:1~5:1)にて精製した。

得られた油状物をエタノールに溶かし、濃塩酸 0.1ml を加え、減圧下に濃縮することにより 7-クロロ-5-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノ]カルボニルメチル-1-(2-メトキシ-4-エトキシベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンの塩酸塩を無色不定形物として得た(0.2 g)。

【0640】

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.98-2.06(13H,m), 2.61-4.88(21H,m), 6.18-7.45(6H,m), 10.42-11.52(1H,m)。

【0641】

実施例 2

4-シクロヘキシル安息香酸 2g に塩化チオニル 20ml を加え、2 時間加熱還流した。

塩化チオニルを留去し、4-シクロヘキシルベンゾイルクロリドを得た。

5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 2.2g のジクロロメタン 50ml 溶液にピリジン 3.3g を加え、次いで氷冷攪拌下先の 4-シクロヘキシルベンゾイルクロリドを加え、室温で終夜攪拌した。

反応液に水を加え、ジクロロメタンにて抽出した。

希塩酸で洗浄、水洗後、硫酸マグネシウムで乾燥した。

減圧下溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン)にて精製して、5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 4g を得た。

【0642】

無色油状

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.27(3H,t,J=7.

cooled in 0 deg C, 7-chloro-5-{N-methyl-N-(2-diethylaminoethyl) amino} carbonyl methyl-2,3,4,5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.5g was added.

Consequently, 2 hours it agitated with that way temperature including triethylamine 0.6ml.

In reaction product with dichloromethane after extracting, it dried with sodium carbonate including water.

It refined with silica gel column chromatography (eluate ;dichloromethane :methanol =50:1~5:1).

It melted oil which it acquires in ethanol, 7-chloro-5-{N-methyl-N-(2-diethylaminoethyl) amino} carbonyl methyl-1-(2-methoxy-4-ethoxy benzoyl)-2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine designating acetate as colorless amorphous ones, by concentrating under vacuum including concentrated hydrochloric acid 0.1 ml, it acquired (0.2 g).

【0640】

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); δ ppm :0.98-2.06 (13 H, m), 2.61 - 4.88 (21 H, m), 6.18 - 7.45 (6 H, m), 10.42 - 11.52(1 H, m).

【0641】

Working Example 2

2 hours heating and refluxing it did in 4-cyclohexyl benzoic acid 2g including thionyl chloride 20ml.

thionyl chloride was removed, 4-cyclohexyl benzoyl chloride were acquired.

5-ethoxy carbonyl methyl-7-chloro-2,3,4,5-tetrahydro-1H-benzo azepine 2.2g to dichloromethane 50ml solution overnight it agitated with room temperature including pyridine 3.3g, under ice cooling agitating ahead 4-cyclohexyl benzoyl chloride including next.

In reaction mixture it extracted with dichloromethane including water.

You washed with dilute hydrochloric acid, after water wash, dried with magnesium sulfate.

Removing solvent under vacuum, refining residue which it acquires with silica gel column chromatography (eluate ;dichloromethane), 5-ethoxy carbonyl methyl-7-chloro-1-(4-cyclohexyl benzoyl)-it acquired 2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 4g.

【0642】

colorless oily

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); δ ppm :

1Hz), 1.20-2.20(14H,m), 2.30-2.50(1H,m), 2.60-3.05(3H,m), 3.10-3.35(1H,m), 4.10-4.40(2H,m), 4.45-4.65(1H,m), 6.57(1H,d,J=8.4Hz), 6.96(1H,d,J=8.1Hz), 7.00(2H,d,J=8.0Hz), 7.10-7.35(3H,m).

【0643】

実施例 3

5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 2g のエタノール 20ml 溶液に 5N 水酸化ナトリウム水溶液 5ml を加え、室温にて終夜攪拌した。

反応液に塩酸を加えて酸性とした後、ジクロロメタンで抽出、水洗後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。

減圧下溶媒を留去して、5-カルボキシメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 1.8g を得た。

【0644】

無色不定形

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.25(14H,m), 2.30-2.55(1H,m), 2.60-3.30(3H,m), 3.50-3.90(1H,m), 4.45-4.60 及び 5.10-5.30(1H,m), 6.15(1H,brs), 6.59(1H,d,J=8.3Hz), 6.85-7.00(3H,m), 7.10-7.35(3H,m).

【0645】

適当な出発原料を用い、実施例 3 と同様にして下記実施例 52、68、77、78、81~83、87、90、96、101、103、104、109、117~118、120 及び 131~135 の化合物を得た。

【0646】

実施例 4

5-カルボキシメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.7g のジクロロメタン 50ml 溶液に氷冷攪拌下、N,N-ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド 0.54g を加え、室温で 15 分間攪拌した。

次いで氷冷攪拌下、N-メチルピペラジン 0.24ml 及びトリエチルアミン 0.46ml を加え、室温で終夜攪拌した。

水を加え、ジクロロメタンで抽出し、水洗後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。

減圧下に溶媒を留去して、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:ジクロロ

ppm :1.27 (3 H, t, J=7.1Hz), 1.20 - 2.20 (14 H, m), 2.30 - 2.50 (1 H, m), 2.60 - 3.05 (3 H, m), 3.10 - 3.35 (1 H, m), 4.10 - 4.40 (2 H, m), 4.45 - 4.65 (1 H, m), 6.57 (1 H, d, J=8.4Hz), 6.96 (1 H, d, J=8.1Hz), 7.00(2 H, d, J=8.0Hz), 7.10 - 7.35 (3 H, m).

【0643】

Working Example 3

5-ethoxy carbonyl methyl -7-chloro -1- (4 -cyclohexyl benzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 2g to ethanol 20ml solution overnight it agitated with room temperature including 5 N sodium hydroxide water solution 5ml .

In reaction mixture after making acidity including hydrochloric acid , it extracted with dichloromethane , after water wash , dried with magnesium sulfate .

Removing solvent under vacuum , 5 -carboxymethyl -7-chloro -1- (4 -cyclohexyl benzoyl) - it acquired 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 1.8g.

【0644】

colorless amorphous

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ; δ ppm :1.20-2.25 (14 H, m), 2.30 - 2.55 (1 H, m), 2.60 - 3.30 (3 H, m), 3.50 - 3.90 (1 H, m), 4.45 - 4.60 and 5.10 - 5.30 (1 H, m), 6.15 (1 H, brs), 6.59 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.85 - 7.00 (3 H, m), 7.10 - 7.35 (3 H, m).

【0645】

Below-mentioned Working Example 52, 68, 77, 78, 81~83, 87, 90, 96, 101, 103 , 104, 109, 117~118, 120 and compound 131 - 135 was acquired making use of suitable starting material , to similar to Working Example 3.

【0646】

Working Example 4

5 -carboxymethyl -7-chloro -1- (4 -cyclohexyl benzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.7g to dichloromethane 50ml solution under ice cooling agitating, 15 min it agitated with room temperature including N, N- bis (2 -oxo -3- oxazol danyl) phosphinic chloride 0.54g.

Next under ice cooling agitating, including N- methyl piperazine 0.24ml and triethylamine 0.46ml , with room temperature overnight it agitated.

Including water, it extracted with dichloromethane , after water wash , dried with magnesium sulfate .

Removing solvent under vacuum , refining residue which it acquires with silica gel column chromatography

メタン:メタノール=40:1)にて精製して、7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.7g を得た。

【0647】

無色不定形

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-3.40(22H, m), 2.21 及び 2.34(3H,s), 3.50-3.90(5H,m), 4.4 0-4.60 及び 5.05-5.20(1H,m), 6.50-6.60(1H,m), 6.85-6.95(1H,m), 7.00-7.15(3H,m), 7.25-7.50(2 H,m)。

【0648】

適当な出発原料を用い、実施例 4 と同様にして下記実施例 7、9、11~18、20~22、24、25、28~36、38~40、46~48、55~67、70~72、74~76、79、84、85、88、91~94、98、121~126、137 及び 138 の化合物を得た。

【0649】

実施例 5

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)アセチル]ベンゾイル}-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 2.06g を塩化メチレン 20ml-メタノール 20ml の混合溶媒に溶解し、氷水浴上冷却攪拌下水素化ホウ素ナトリウム 0.28g を添加した。

氷水浴上冷却下 2 時間攪拌後溶媒の大部分を減圧下留去した。

残渣に水を加え塩化メチレン抽出した。

有機層を飽和食塩水洗、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。

残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:塩化メチレン:メタノール=20:10:1)で精製し、無色不定形として 7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシエチル]ベンゾイル}-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを 2.08g 得た。

【0650】

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-4.0,4.35-4.65,4.65-5.0 及び 5.0-5.25(全 27H,m), 6.4-6.65(1 H,m), 6.75-7.6(10H,m)。

【0651】

適当な出発原料を用い、実施例 5 と同様にして下記実施例 22、46 及び 94 の化合物を得た。

(eluate ;dichloromethane :methanol =40:1), 7 -chloro -5- { (4 -methyl -1- piperazinyl) carbonyl methyl } - 1 - (4 -cyclohexyl benzoyl) - it acquired 2, 3, 4and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.7g.

【0647】

colorless amorphous

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;δ ppm :1.20-3.40 (22 H, m), 2.21 and 2.34 (3 H, s), 3.50 - 3.90 (5 H, m), 4.40 - 4.60and 5.05 - 5.20 (1 H, m), 6.50 - 6.60 (1 H, m), 6.85 - 6.95 (1 H, m), 7.00 - 7.15 (3 H, m),7.25 - 7.50 (2 H, m).

【0648】

Below-mentioned Working Example 7, 9, 11~18, 20~22, 24, 25, 28~36, 38~40, 46~48, 55~67, 70~72, 74~76, 79, 84, 85, 88, 91~94, 98, 121~126, 137 and compound of 138 were acquired making use of suitable starting material , to similar to Working Example 4.

【0649】

Working Example 5

7 -chloro -5- { (4 -methyl -1- piperazinyl) carbonyl methyl } - 1 - {4 - {2 - (2 -methylphenyl) acetyl } benzoyl } - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 2.06g were melted in mixed solvent of methylene chloride 20ml -methanol 20ml , cooling churning sewage element conversion boron sodium 0.28g on ice water bath was added.

Under cooling on ice water bath major portion of 2 hours after stirring solvent was removed under the vacuum .

methylene chloride it extracted in residue including water.

organic layer was concentrated saturated saline washing, after magnesium sulfate drying .

residue was refined with silica gel column chromatography (eluate :methylene chloride :methanol =20:10:1), 7 -chloro -5- { (4 -methyl -1- piperazinyl) carbonyl methyl } - 1 - {4 - {2 - (2 -methylphenyl) - 1 -hydroxyethyl } benzoyl } - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 2.08 g were acquired as colorless amorphous .

【0650】

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;δ ppm :1.1 - 4.0, 4.35-4.65, 4.65-5.0 and 5.0 - 5.25 (All 27 H, m), 6.4 - 6.65 (1 H, m), 6.75 - 7.6 (10 H, m).

【0651】

Below-mentioned Working Example 22, 46 and compound of 94 were acquired making use of suitable starting material , to similar to Working Example 5

【0652】

実施例 6

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[4-[2-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシエチル]ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.5g, 酢酸 5ml 及び無水酢酸 3 ml に濃硫酸 1 滴を加え室温で 12 時間、続いて 60~70 deg C で 6 時間攪拌した。

反応混合物を氷水に注ぎ、酢酸エチル 30ml を加え、このものに重曹を加えてアルカリ性にした。

全体を酢酸エチルで抽出した後、有機相を飽和重曹水洗、飽和食塩水洗、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。

残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:塩化メチレン:メタノール=20:1)で精製し、無色不定形として 7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[4-[2-(2-メチルフェニル)-1-アセチルオキシエチル]ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを 0.36g 得た。

【0653】

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-4.0,4.35-4.7 及び 4.95-5.25(全 28H,m), 5.7-6.0(1H,m), 6.4-6.65(1H,m), 6.75-7.6(10H,m)。

【0654】

適当な出発原料を用いて、実施例 6 と同様にして下記実施例 12 及び 48 の化合物を得た。

【0655】

適当な出発原料を用い、実施例 1 及び 2 と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【0656】

【表 58】

to similar to Working Example 5.

【0652】

Working Example 6

7-chloro-5-{(4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl} - 1 - {4 - {2 - (2-methylphenyl) - 1-hydroxyethyl} benzoyl} - 2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.5g, acetic acid 5ml and to acetic anhydride 3ml with the room temperature 12 hours, continuously 6 hours it agitated with 60 - 70 deg C including concentrated sulfuric acid 1 drop .

In this you made alkalinity including sodium bicarbonate you poured reaction mixture to ice water , including ethylacetate 30ml .

After extracting entirety with ethylacetate , organic phase was concentrated sodium bicarbonate-saturated water washing and saturated saline washing, after magnesium sulfate drying .

residue was refined with silica gel column chromatography (eluate ;methylene chloride :methanol =20:1) , 7-chloro-5-{(4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl} - 1 - {4 - {2 - (2-methylphenyl) - 1-acetyl oxyethyl} benzoyl} - 2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.36 g were acquired as colorless amorphous .

【0653】

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;de ppm :1.1- 4.0, 4.35-4.7 and 4.95 - 5.25 (All 28 H, m) , 5.7 - 6.0 (1 H, m) , 6.4 - 6.65 (1 H, m) , 6.75 - 7.6 (10 H, m) .

【0654】

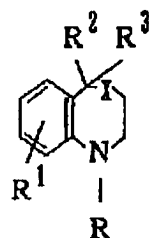
Below-mentioned Working Example 12 and compound of 48 were acquired making use of suitable starting material , to similar to Working Example 6.

【0655】

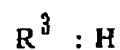
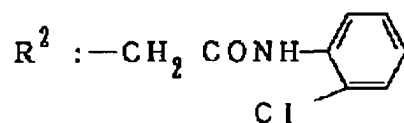
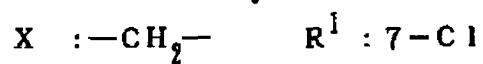
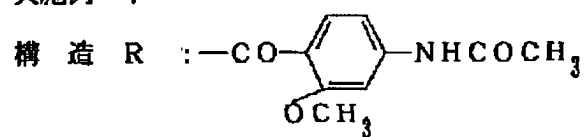
compound which is stated in below-mentioned chart making use of suitable starting material , to similar to Working Example 1 and 2 was acquired.

【0656】

【Table 58】



実施例 7



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融 点 : 146-148℃

形 態 : 遊 離

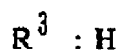
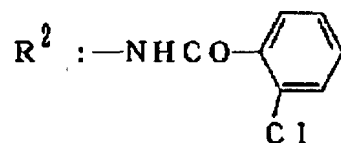
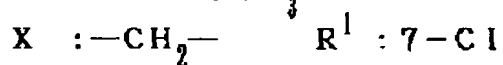
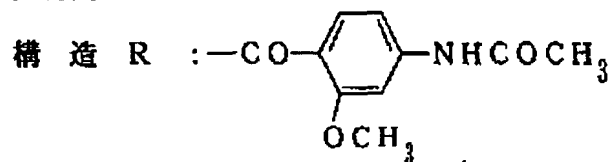
【0657】

【表 59】

【0657】

【Table 59】

実施例 8



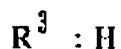
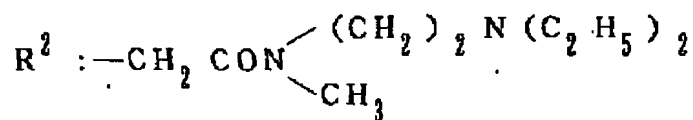
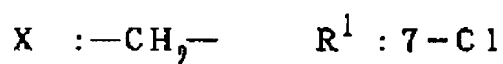
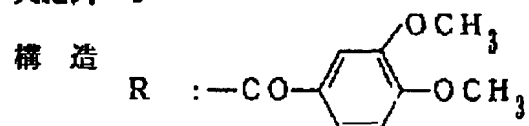
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 184-186℃

形態 : 遊離

実施例 9



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 1)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0658】

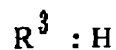
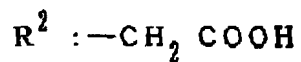
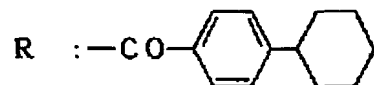
[0658]

【表 60】

[Table 60]

実施例 10

構造



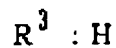
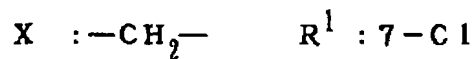
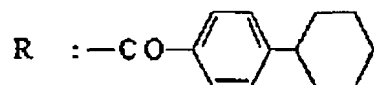
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 2)

形態 : 遊離

実施例 11

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 3)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0659】

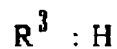
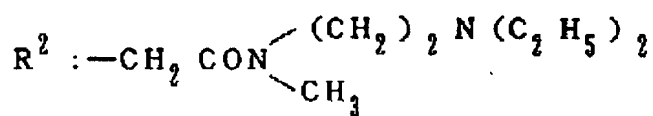
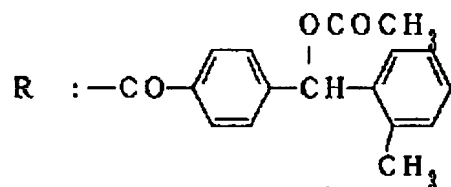
[0659]

【表 61】

[Table 61]

実施例 12

構造

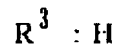
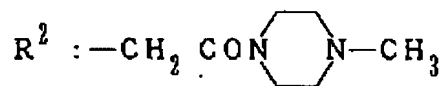
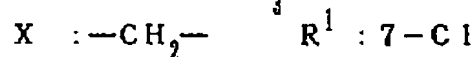
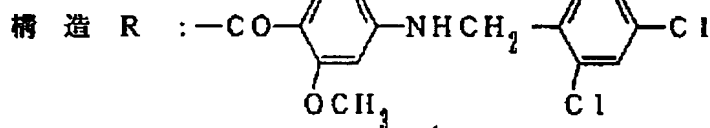


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 4)

形態 : 塩酸塩

実施例 13



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 186-187°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

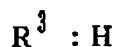
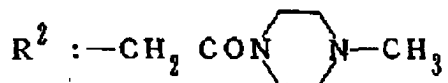
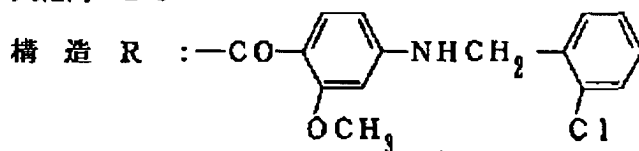
【0660】

[0660]

【表 62】

[Table 62]

実施例 14



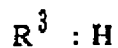
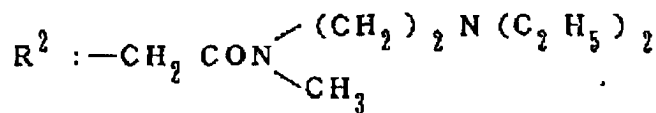
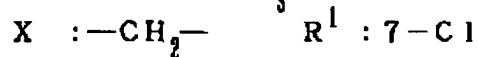
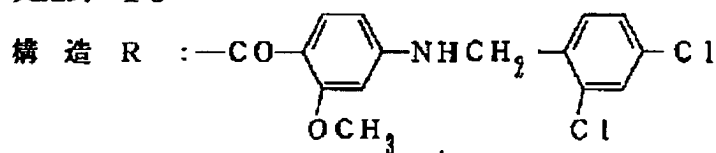
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融 点 : 162-162.5℃

形 態 : 遊 離

実施例 15



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 5)

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

【0661】

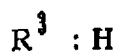
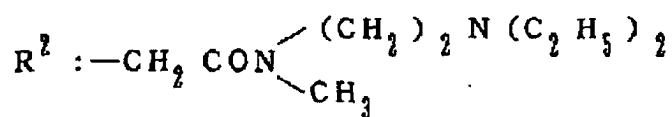
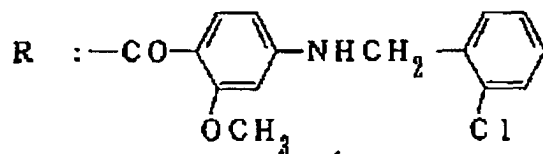
[0661]

【表 63】

[Table 63]

実施例 16

構造



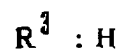
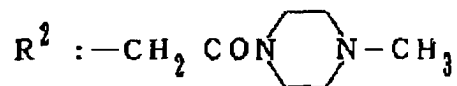
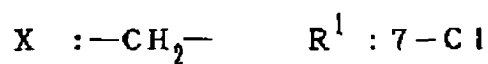
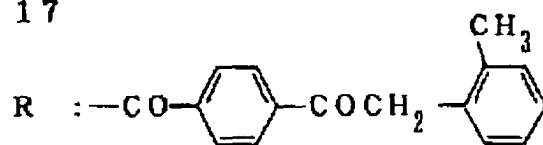
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 6)

形態 : 遊離

実施例 17

構造



結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 181-182.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

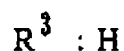
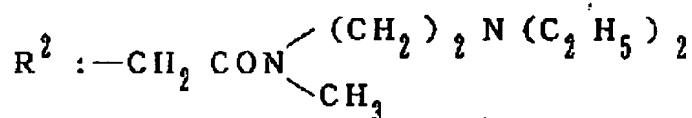
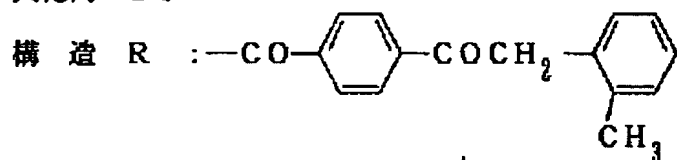
【0662】

[0662]

【表 64】

[Table 64]

実施例 18



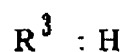
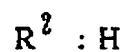
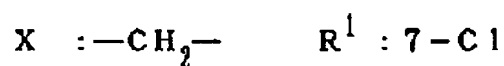
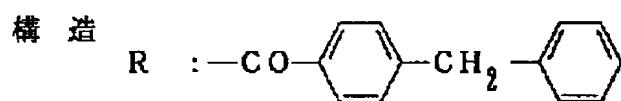
結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 123-126°C

形態 : 遊離

実施例 19



結晶形 : 無色板状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 87.5-88°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0663】

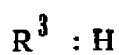
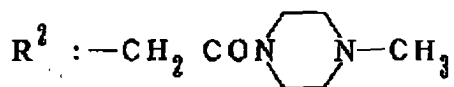
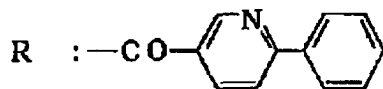
[0663]

【表 65】

[Table 65]

実施例 20

構造



結晶形 : 白色粉末状

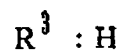
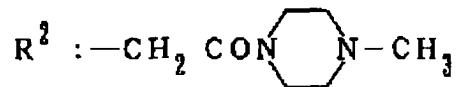
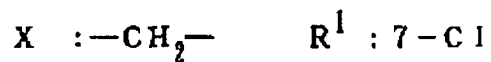
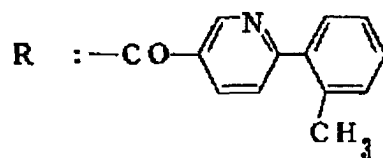
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 152-153℃

形態 : 遊離

実施例 21

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 7)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0664】

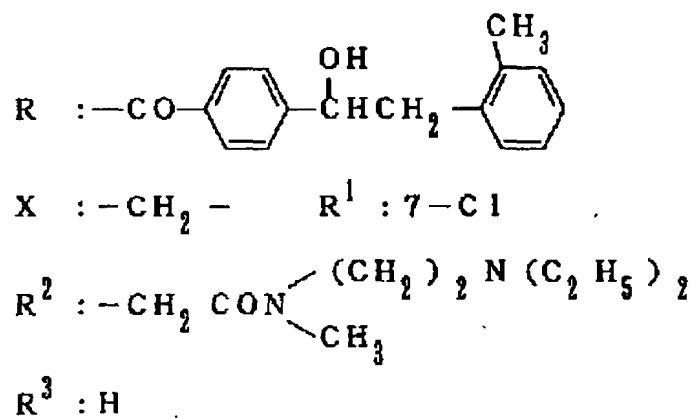
[0664]

【表 66】

[Table 66]

実施例 22

構造



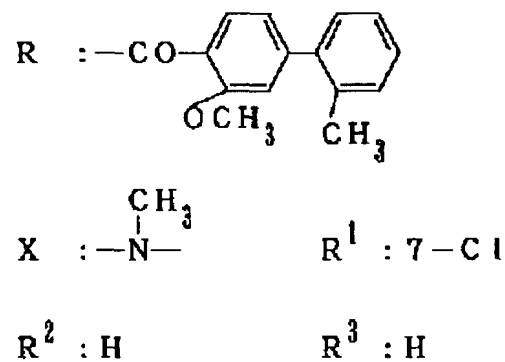
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 8)

形態 : 遊離

実施例 23

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 9)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0665】

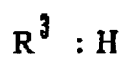
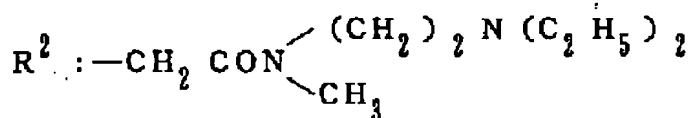
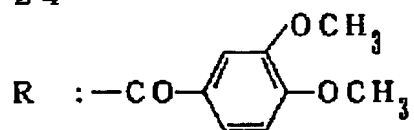
[0665]

【表 67】

[Table 67]

実施例 24

構造



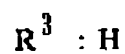
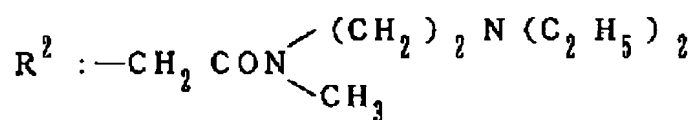
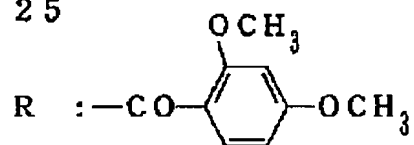
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 7.9)

形態 : 遊離

実施例 25

構造



結晶形 : 淡黄色不定形

NMRスペクトル : 1.0)

形態 : 塩酸塩

JP1997221476A

1997-8-26

【0666】

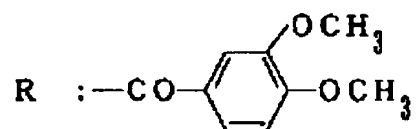
[0666]

【表 68】

[Table 68]

実施例 26

構造



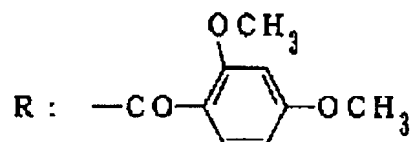
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 11)

形態 : 遊離

実施例 27

構造



結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 12)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

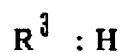
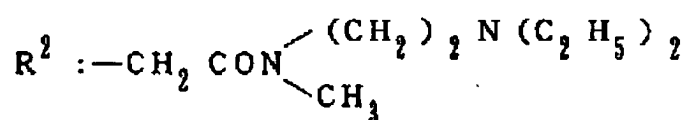
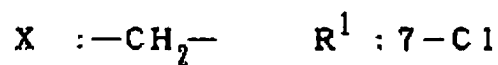
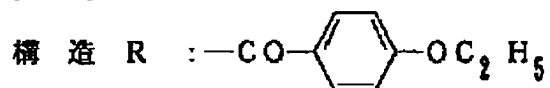
【0667】

[0667]

【表 69】

[Table 69]

実施例 28

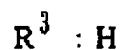
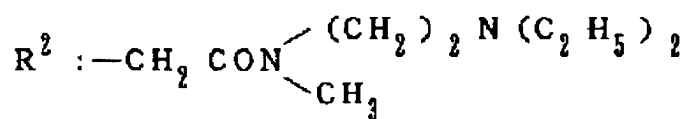
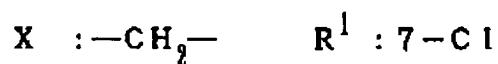
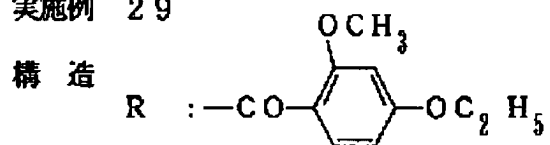


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 13)

形態 : 塩酸塩

実施例 29



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 14)

形態 : 塩酸塩

JP1997221476A

1997-8-26

【0668】

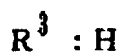
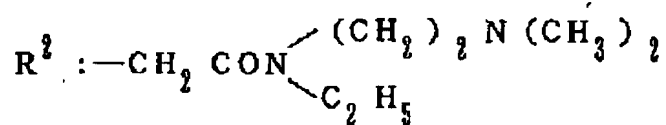
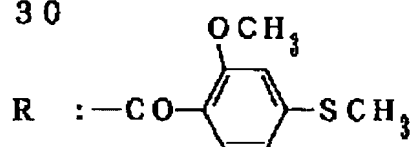
[0668]

【表 70】

[Table 70]

実施例 30

構造



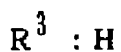
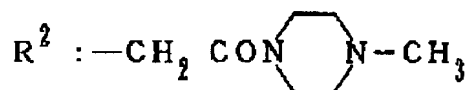
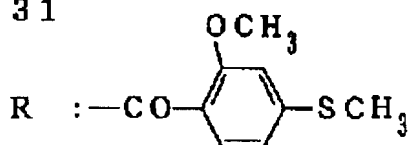
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 15)

形態 : 塩酸塩

実施例 31

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 16)

形態 : 塩酸塩

JP1997221476A

1997-8-26

【0669】

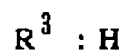
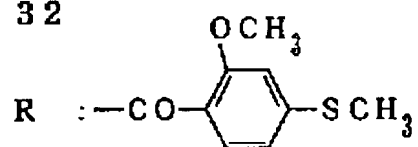
[0669]

【表 71】

[Table 71]

実施例 32

構造



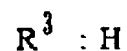
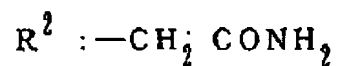
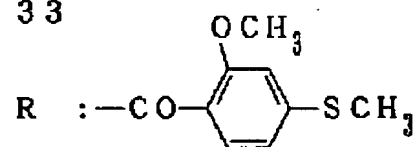
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 17)

形態 : 塩酸塩

実施例 33

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 104-108℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

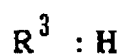
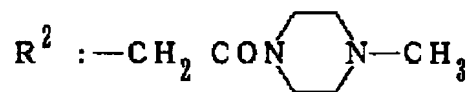
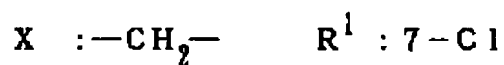
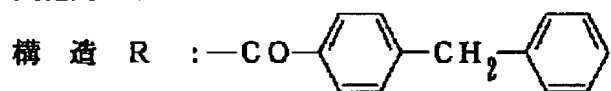
【0670】

[0670]

【表 72】

[Table 72]

実施例 34

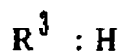
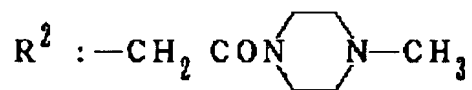
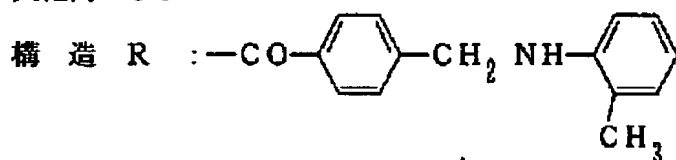


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 18)

形態 : 遊離

実施例 35



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 19)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

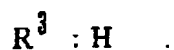
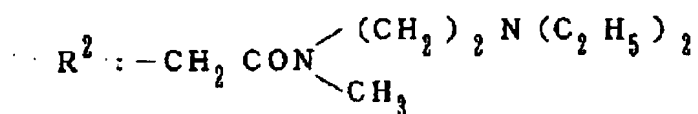
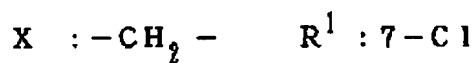
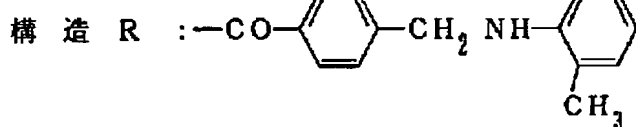
【0671】

[0671]

【表 73】

[Table 73]

実施例 36

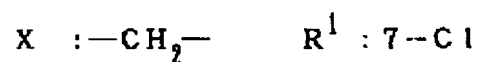
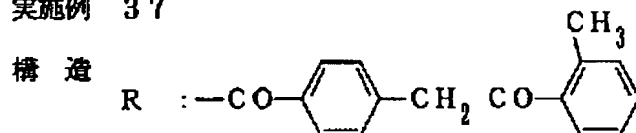


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 20)

形態 : 遊離

実施例 37



結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

融点 : 145-147℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0672】

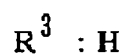
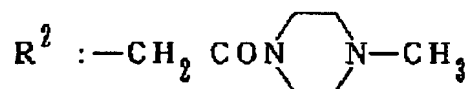
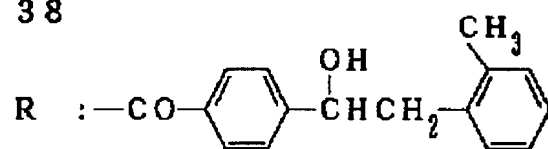
[0672]

【表 74】

[Table 74]

実施例 38

構造



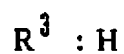
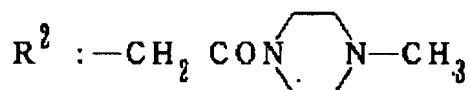
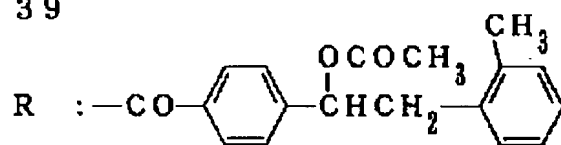
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 21)

形態 : 遊離

実施例 39

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 22)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

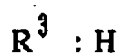
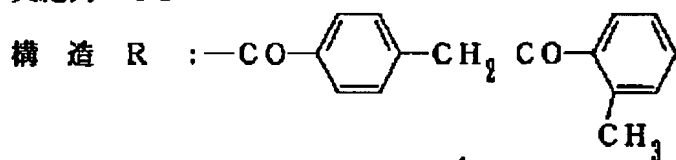
【0673】

[0673]

【表 75】

[Table 75]

実施例 40

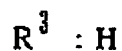
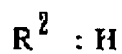
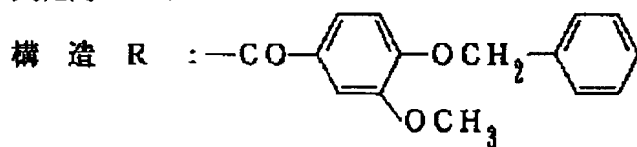


結晶形 : 淡黄色粘稠油

NMRスペクトル : 23)

形態 : 遊離

実施例 41



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 133-133.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

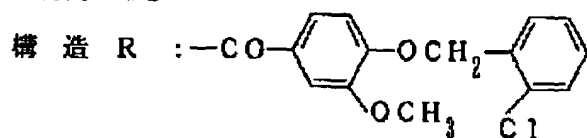
【0674】

[0674]

【表 76】

[Table 76]

実施例 42



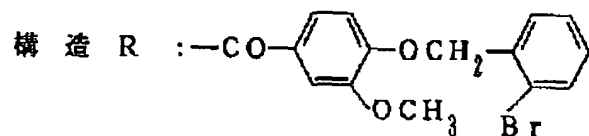
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 135℃

形態 : 遊離

実施例 43



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 133℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

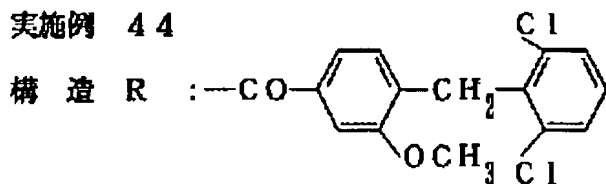
【0675】

[0675]

【表 77】

[Table 77]

実施例 44



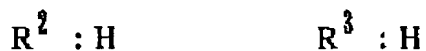
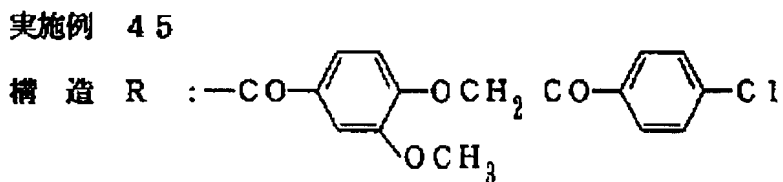
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 154℃

形態 : 遊離

実施例 45



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 166℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

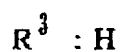
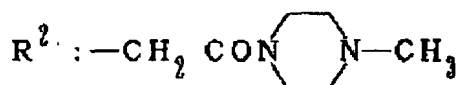
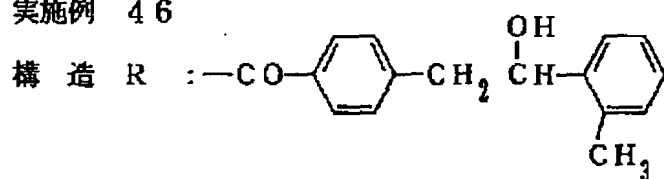
【0676】

[0676]

【表 78】

[Table 78]

実施例 46

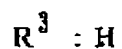
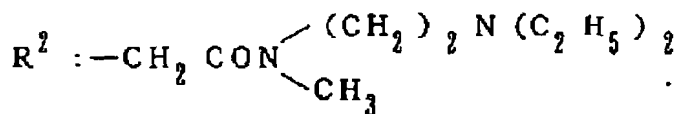
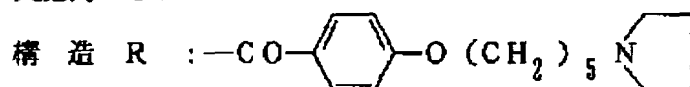


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 24)

形 態 : 遊 離

実施例 47



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 25)

形 態 : 2塩酸塩

JP1997221476A

1997-8-26

【0677】

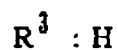
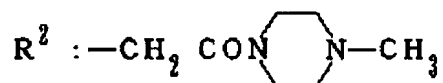
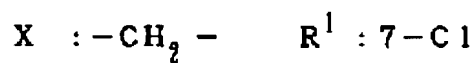
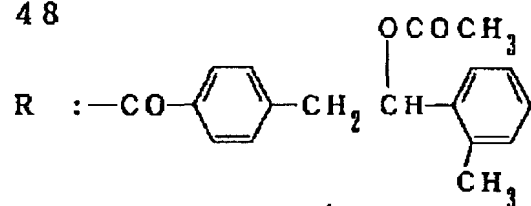
[0677]

【表 79】

[Table 79]

実施例 48

構造



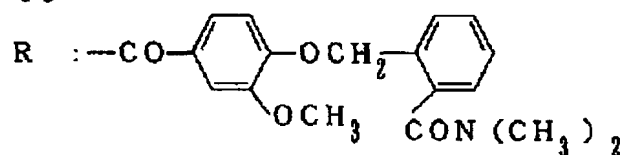
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 26)

形態 : 遊離

実施例 49

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 27)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

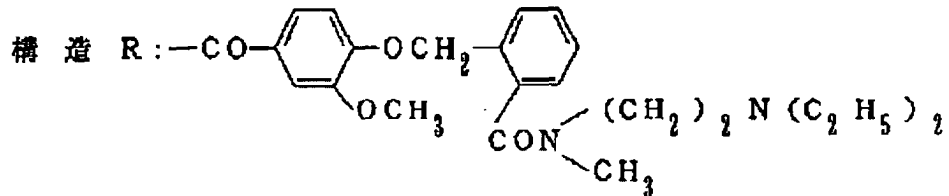
【0678】

[0678]

【表 80】

[Table 80]

実施例 50

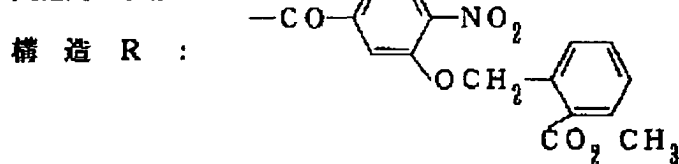


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 28)

形態 : 塩酸塩

実施例 51



結晶形 : 黄色板状晶

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 125℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0679】

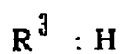
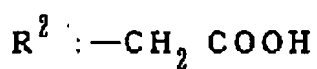
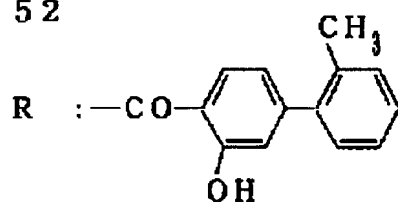
[0679]

【表 81】

[Table 81]

実施例 52

構造



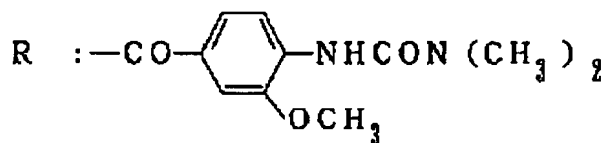
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 80)

形態 : 遊離

実施例 53

構造



結晶形 : 白色板状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 230-232℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

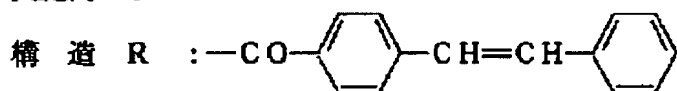
【0680】

[0680]

【表 82】

[Table 82]

実施例 54

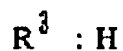
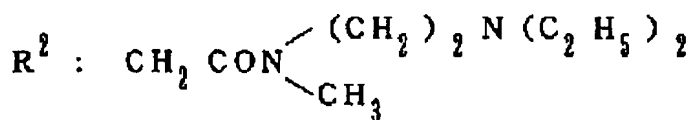
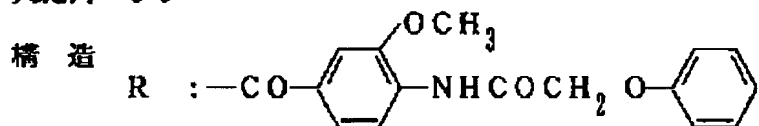


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 81)

形態 : 遊離

実施例 55



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 82)

形態 : 塩酸塩

JP1997221476A

1997-8-26

【0681】

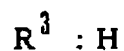
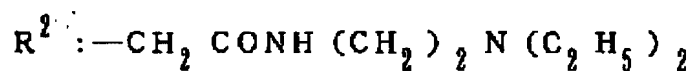
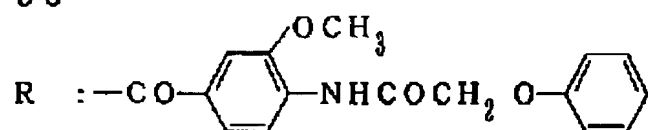
[0681]

【表 83】

[Table 83]

実施例 56

構造



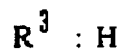
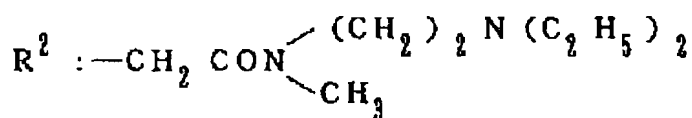
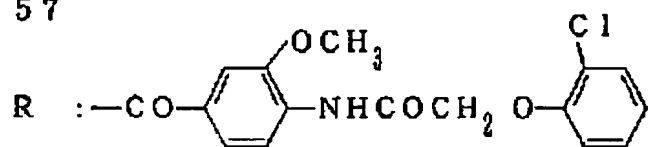
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 83)

形態 : 塩酸塩

実施例 57

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 84)

形態 : 塩酸塩

JP1997221476A

1997-8-26

【0682】

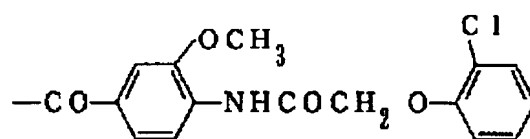
[0682]

【表 84】

[Table 84]

実施例 58

構造


 $X : -CH_2-$ $R^1 : 7-Cl$
 $R^2 : -CH_2 CONH(CH_2)_2 N(C_2H_5)_2$
 $R^3 : H$

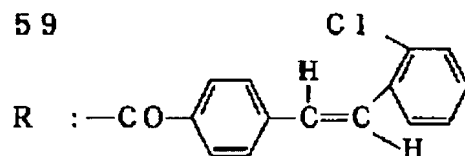
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 85)

形態 : 塩酸塩

実施例 59

構造


 $X : -CH_2-$ $R^1 : 7-Cl$
 $R^2 : -CH_2 CON(CH_3)(CH_2)_2 N(C_2H_5)_2$
 $R^3 : H$

結晶形 : 無色粘稠油

NMRスペクトル : 29)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

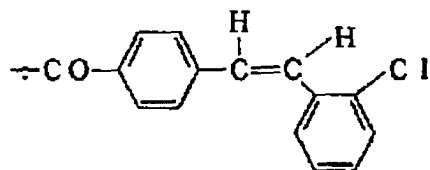
【0683】

[0683]

【表 85】

[Table 85]

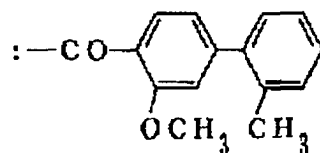
構造 R


$$X : -CH_2- \quad R^1 : 7-Cl$$
$$R^2 : -CH_2 \underset{\substack{| \\ CH_3}}{CON} (CH_2)_2 N (C_2 H_5)_2$$
$$R^3 : H$$

NMRスペクトル : 30)

形 態：遊 離

構造 R


$$X : -CH_2- \quad R^1 : 7-Cl$$
$$R^2 : -CH_2 \text{ CON} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \diagdown \quad \diagup \end{array} N - C_2 H_5$$
$$R^3 : H$$

NMRスペクトル : 31)

形 態： 塩酸塩

JP1997221476A

1997-8-26

【0684】

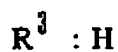
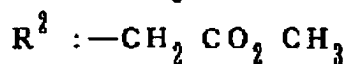
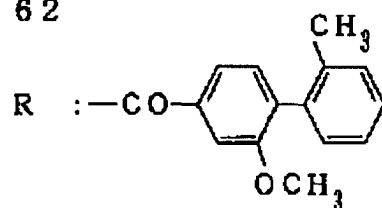
[0684]

【表 86】

[Table 86]

実施例 62

構造



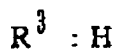
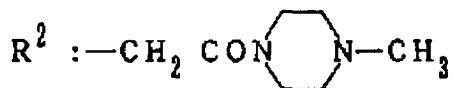
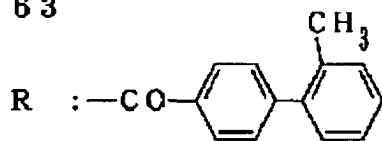
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 32)

形態 : 遊離

実施例 63

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 33)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0685】

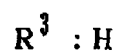
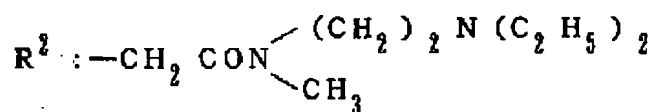
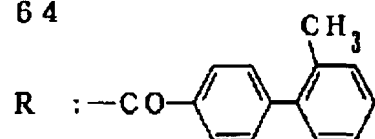
[0685]

【表 87】

[Table 87]

実施例 64

構造



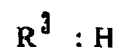
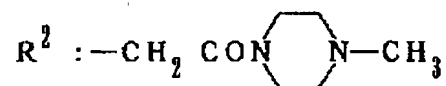
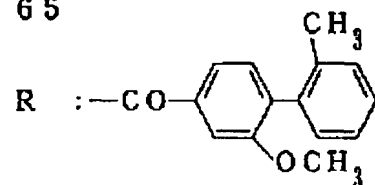
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 34)

形態 : 遊離

実施例 65

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 35)

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0686】

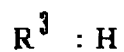
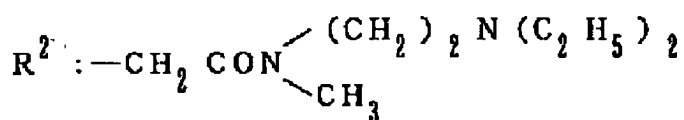
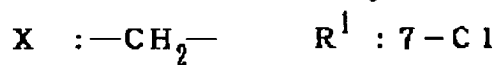
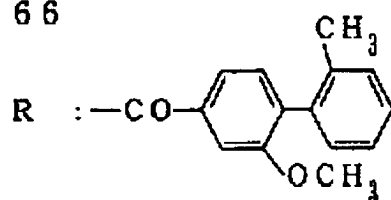
[0686]

【表 88】

[Table 88]

実施例 66

構造



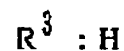
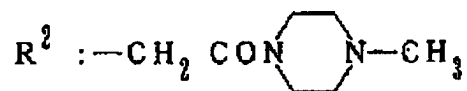
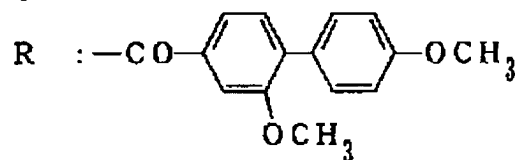
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 36)

形態 : HCl

実施例 67

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 174-176°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

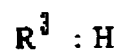
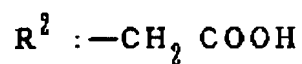
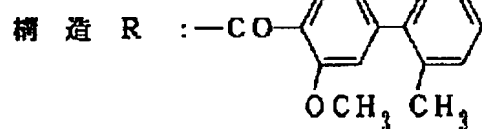
【0687】

[0687]

【表 89】

[Table 89]

実施例 68



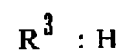
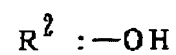
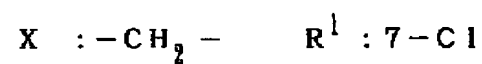
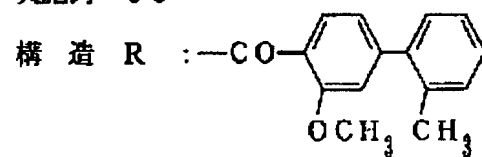
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 203-204℃

形態 : 遊離

実施例 69



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 37)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

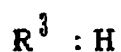
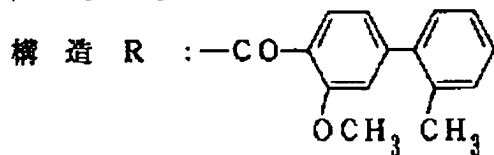
【0688】

[0688]

【表 90】

[Table 90]

実施例 70



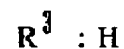
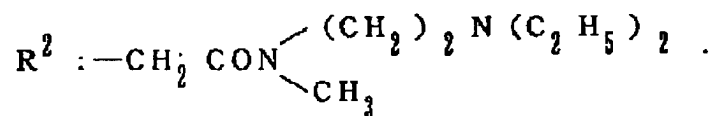
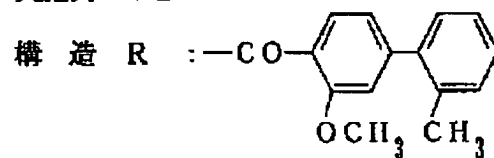
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 181-182℃

形態 : 遊離

実施例 71



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 38)

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

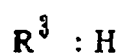
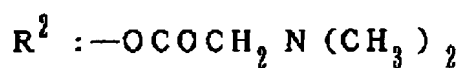
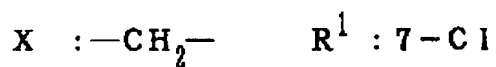
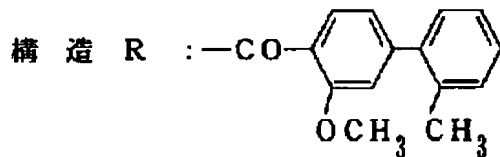
【0689】

[0689]

【表 91】

[Table 91]

実施例 72



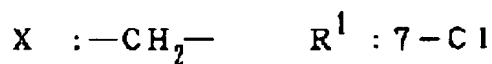
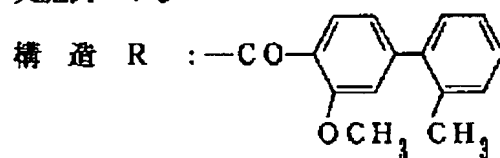
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : $153-155^\circ\text{C}$

形態 : HCl

実施例 73



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 39)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

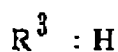
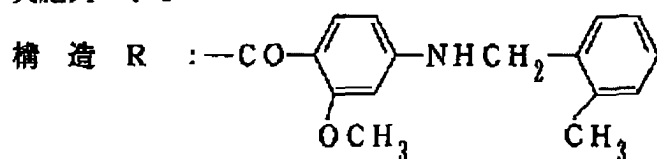
【0690】

[0690]

【表 92】

[Table 92]

実施例 74



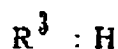
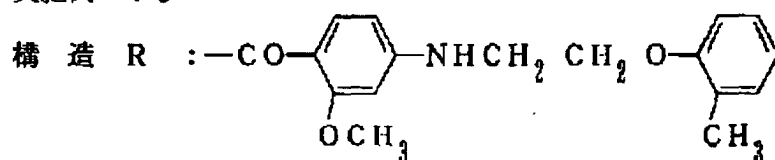
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 153-154.5℃

形態 : 遊離

実施例 75



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 160-161℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

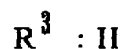
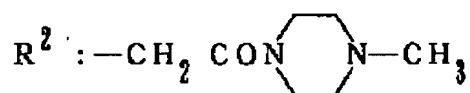
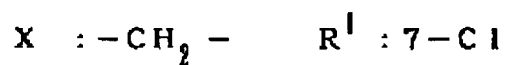
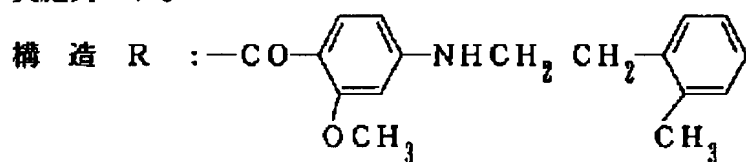
【0691】

[0691]

【表 93】

[Table 93]

実施例 76



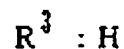
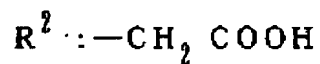
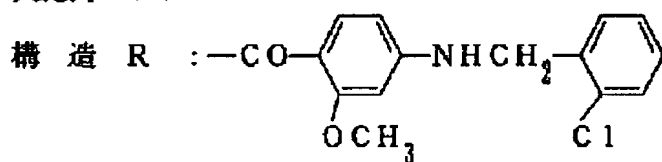
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 135-136℃

形 態 : 遊 離

実施例 77



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融 点 : 134-136.5℃

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

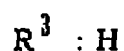
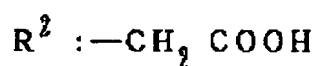
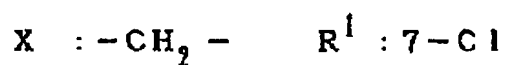
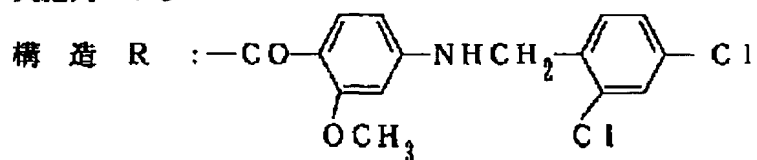
【0692】

[0692]

【表 94】

[Table 94]

実施例 78



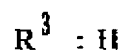
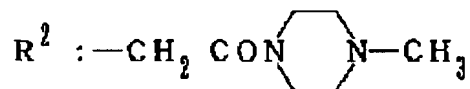
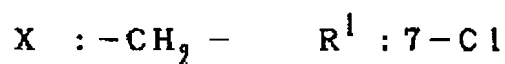
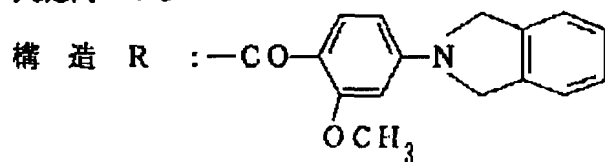
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 140.5-142℃

形態 : 遊離

実施例 79



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 199.5-202℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0693】

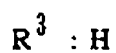
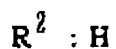
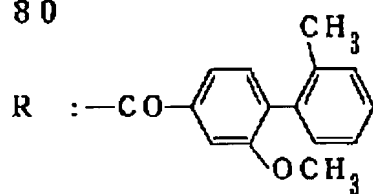
[0693]

【表 95】

[Table 95]

実施例 80

構造



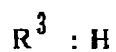
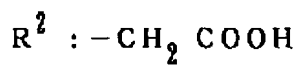
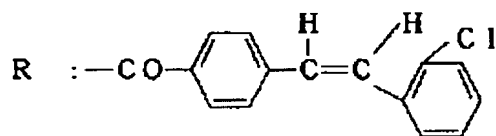
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 40)

形態 : 遊離

実施例 81

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 187-190℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0694】

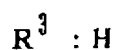
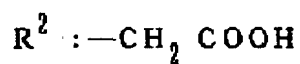
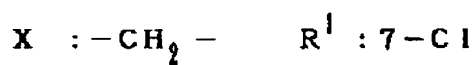
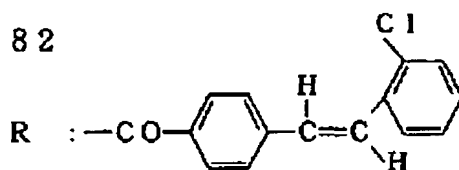
[0694]

【表 96】

[Table 96]

実施例 82

構造



結晶形 : 白色粉末状

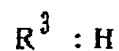
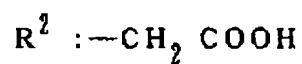
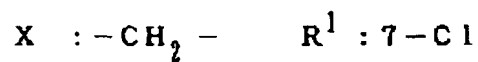
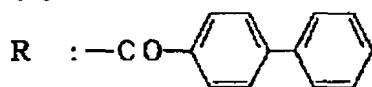
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 189-192℃

形態 : 遊離

実施例 83

構造



結晶形 : 白色粉末状

融点 : 205-207℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

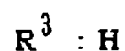
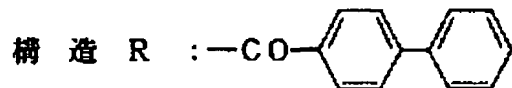
【0695】

[0695]

【表 97】

[Table 97]

実施例 84

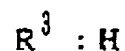
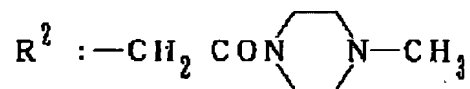
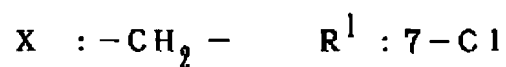
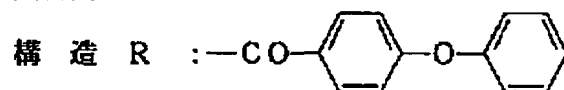


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 41)

形 態 : 遊 離

実施例 85



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 42)

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

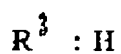
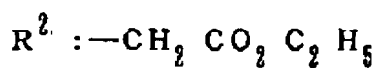
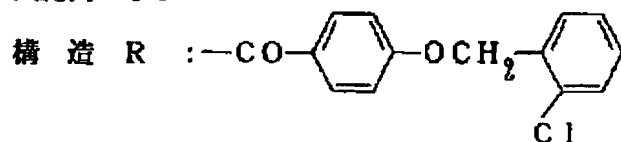
【0696】

[0696]

【表 98】

[Table 98]

実施例 86

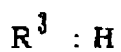
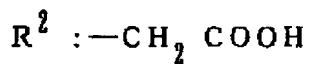
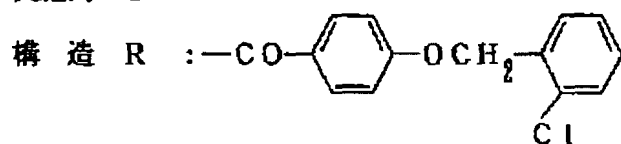


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 43)

形態 : 遊離

実施例 87



結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 44)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

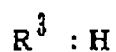
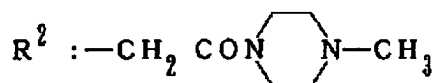
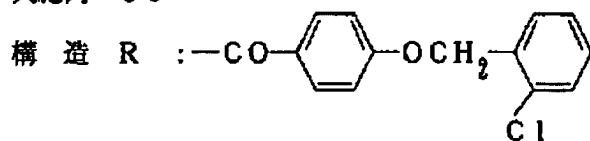
【0697】

[0697]

【表 99】

[Table 99]

実施例 88

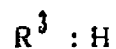
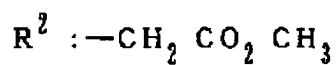
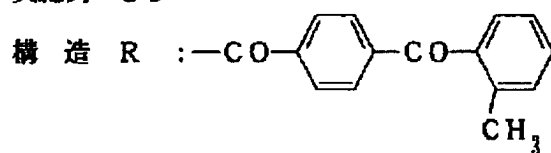


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 45)

形態 : 遊離

実施例 89



結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 46)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

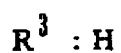
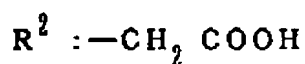
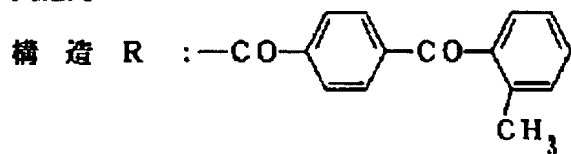
【0698】

{0698}

【表 100】

[Table 100]

実施例 90

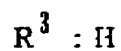
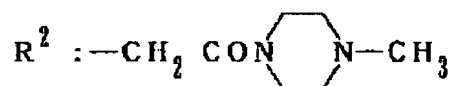
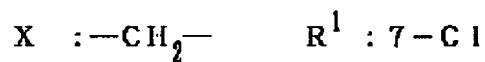
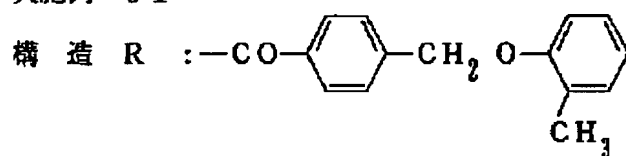


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 47)

形 態 : 遊 離

実施例 91



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融 点 : 84-88℃

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

【0699】

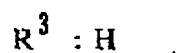
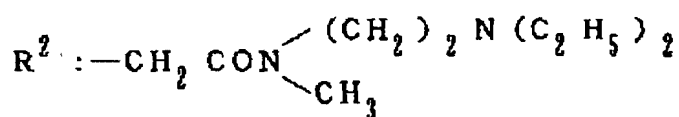
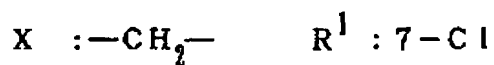
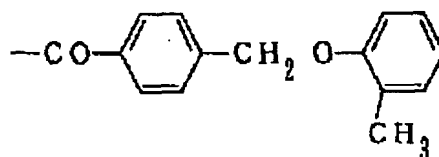
[0699]

【表 101】

[Table 101]

実施例 92

構造



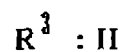
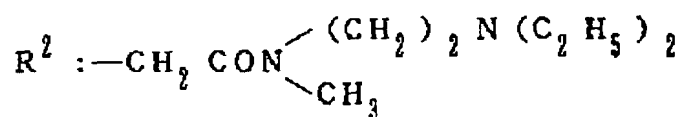
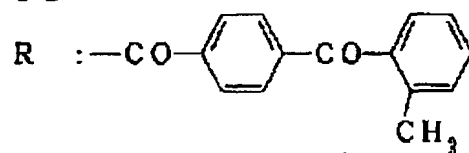
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 48)

形態 : 遊離

実施例 93

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 49)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

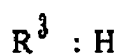
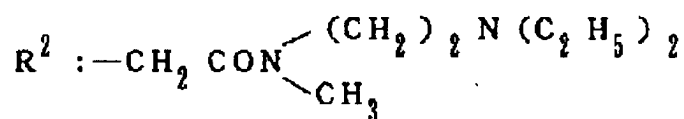
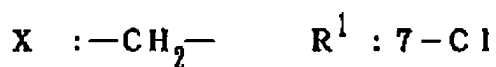
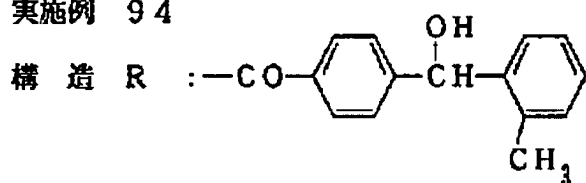
【0700】

[0700]

【表 102】

[Table 102]

実施例 94

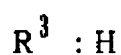
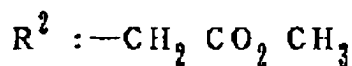
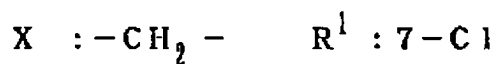
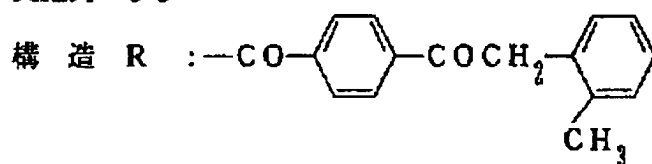


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 50)

形 態 : 遊 離

実施例 95



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

融 点 : 120-122℃

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

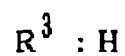
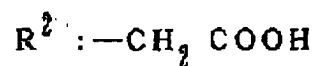
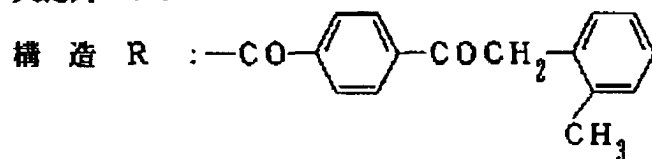
【0701】

[0701]

【表 103】

[Table 103]

実施例 96

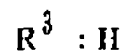
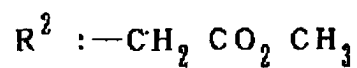
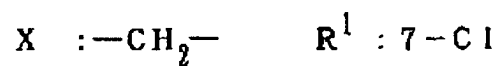
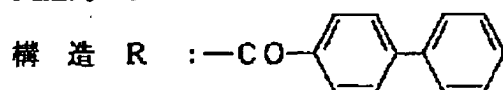


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 51)

形態 : 遊離

実施例 97



結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 52)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

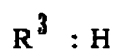
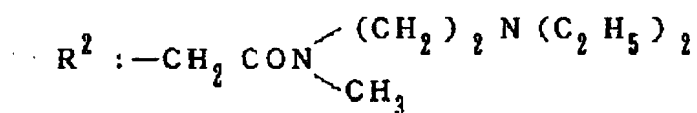
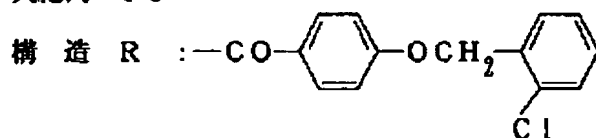
【0702】

[0702]

【表 104】

[Table 104]

実施例 98

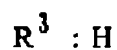
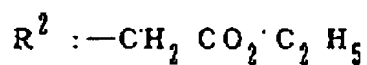
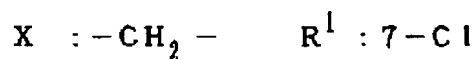
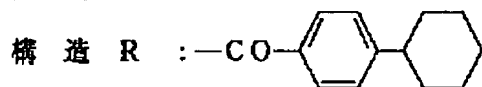


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 53)

形態 : 遊離

実施例 99



結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 54)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

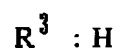
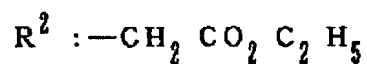
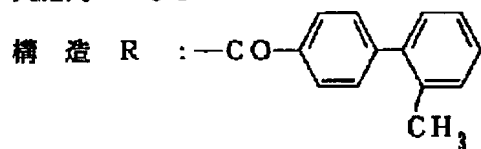
【0703】

[0703]

【表 105】

[Table 105]

実施例 100

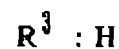
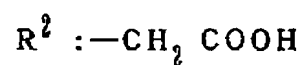
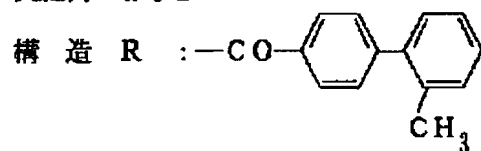


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 55)

形 態 : 遊 離

実施例 101



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 56)

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

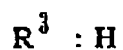
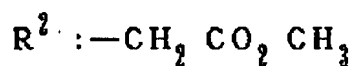
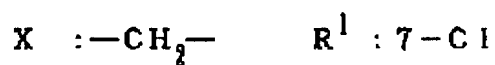
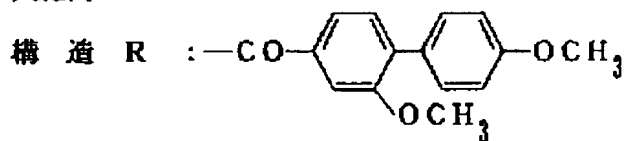
【0704】

[0704]

【表 106】

[Table 106]

実施例 102

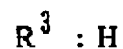
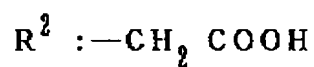
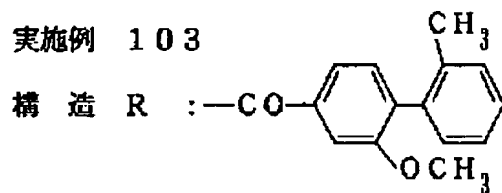


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 57)

形態 : 遊離

実施例 103



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 58)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

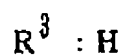
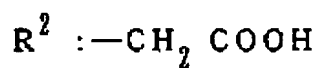
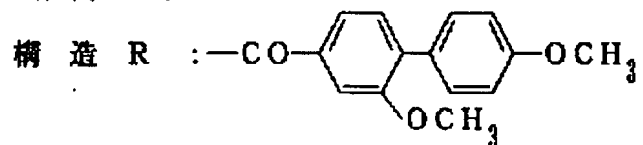
【0705】

[0705]

【表 107】

[Table 107]

実施例 104

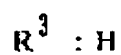
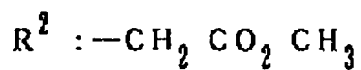
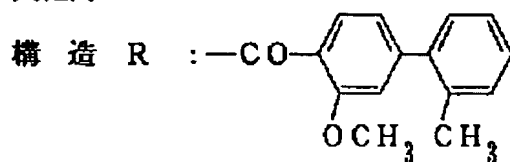


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 59)

形態 : 遊離

実施例 105



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 60)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

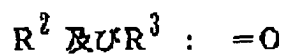
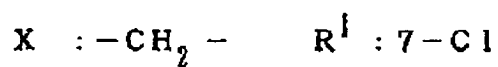
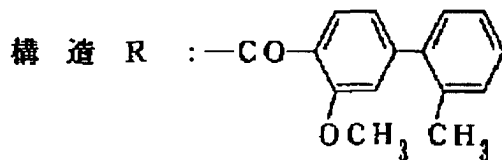
【0706】

[0706]

【表 108】

[Table 108]

実施例 106



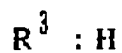
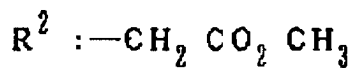
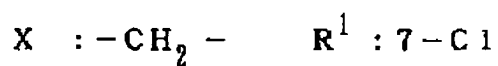
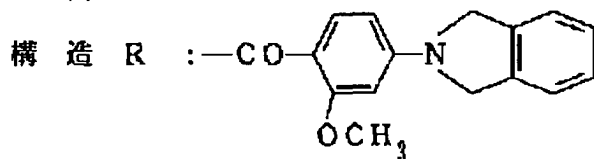
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

NMRスペクトル : 61)

形態 : 遊離

実施例 107



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 62)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

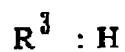
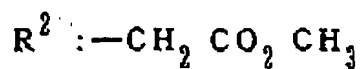
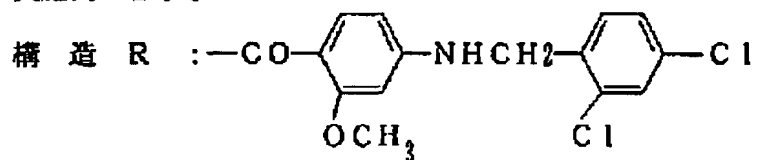
【0707】

[0707]

【表 109】

[Table 109]

実施例 108

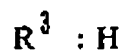
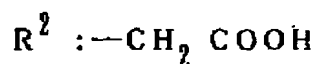
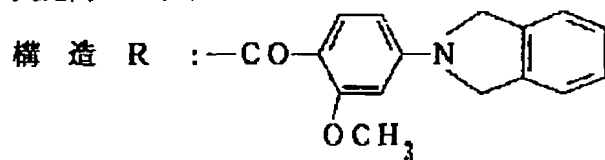


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 63)

形態 : 遊離

実施例 109



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 169-171℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

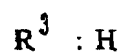
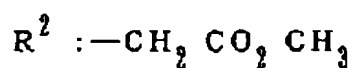
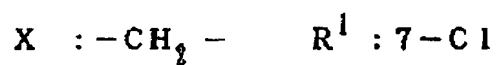
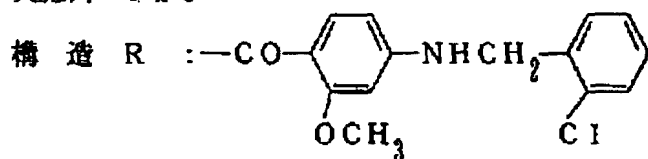
【0708】

[0708]

【表 110】

[Table 110]

実施例 110

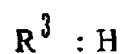
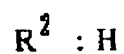
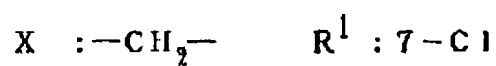
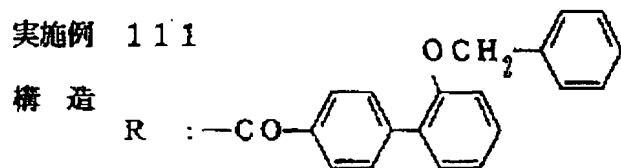


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 64)

形 態 : 遊 離

実施例 111



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 65)

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

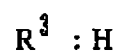
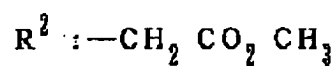
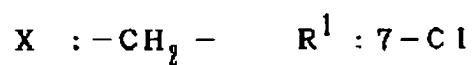
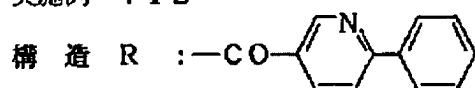
【0709】

[0709]

【表 111】

[Table 111]

実施例 112



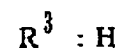
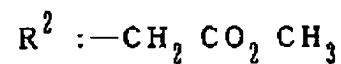
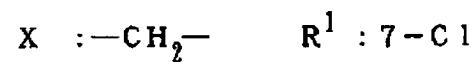
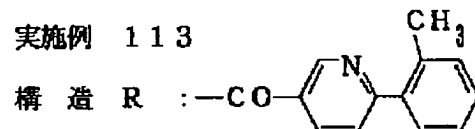
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 139.5-142℃

形態 : 遊離

実施例 113



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 66)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0710】

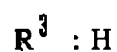
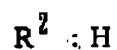
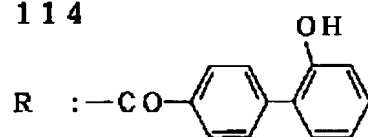
[0710]

【表 112】

[Table 112]

実施例 114

構造



結晶形 : 白色粉末状

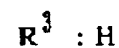
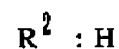
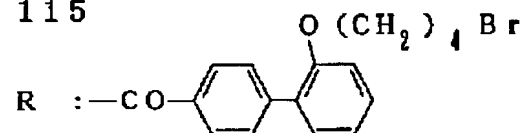
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 226℃

形態 : 遊離

実施例 115

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 142-142.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

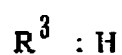
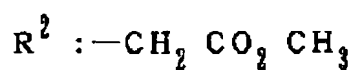
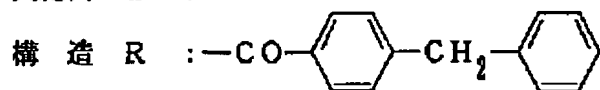
【0711】

[0711]

【表 113】

[Table 113]

実施例 116

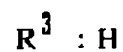
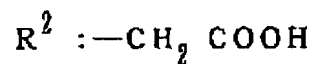
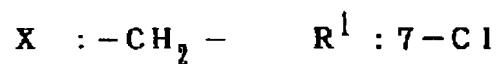
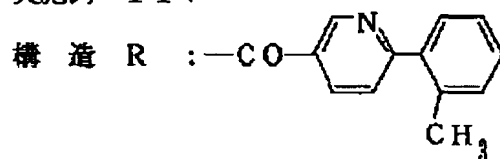


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 67)

形態 : 遊離

実施例 117



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 235-237℃ (分解)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

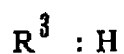
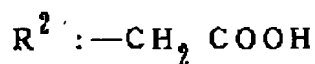
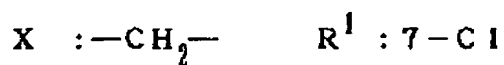
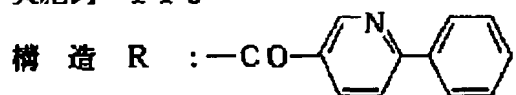
【0712】

[0712]

【表 114】

[Table 114]

実施例 118



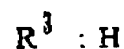
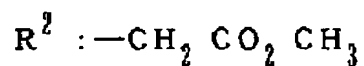
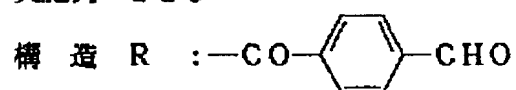
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 183℃

形態 : 遊離

実施例 119



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

NMRスペクトル : 6.8)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26


【0713】

[0713]

【表 115】

[Table 115]

実施例 120

構造 R : -CHOX : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : 7-\text{Cl}$ $\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$ $\text{R}^3 : \text{H}$


結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融 点 : 192°C

形 態 : 遊 離

実施例 121

構造 R : -CHOX : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : 7-\text{Cl}$ $\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{CON} \langle \text{piperidine ring} \rangle \text{N}-\text{CH}_3$ $\text{R}^3 : \text{H}$

結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 69)

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

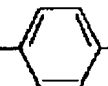
【0714】

[0714]

【表 116】

[Table 116]

実施例 122

構造 R :  -CHO

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2 \text{ CON} \begin{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_2 \text{N} (\text{C}_2\text{H}_5)_2 \\ \text{---} \text{CH}_3 \end{matrix}$

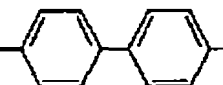
R³ : H

結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 70)

形態 : 遊離

実施例 123

構造 R :  $-(\text{CH}_2)_2 \text{CH}_3$

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2 \text{ CON} \begin{matrix} \text{---} \text{C}_2\text{H}_5 \end{matrix}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 71)

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0715】

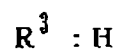
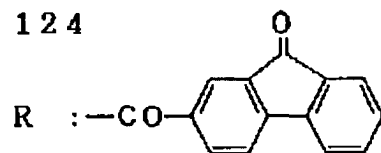
[0715]

【表 117】

[Table 117]

実施例 124

構造



結晶形 : 黄色粉末状

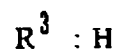
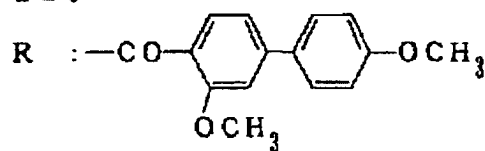
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 182-184℃

形態 : HCl

実施例 125

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 72)

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0716】

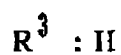
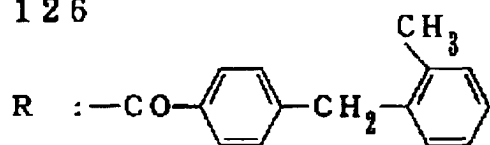
[0716]

【表 118】

[Table 118]

実施例 126

構造



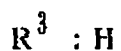
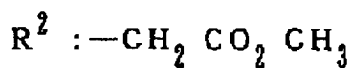
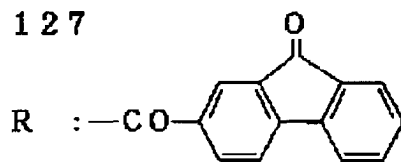
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 73)

形態 : HCl

実施例 127

構造



結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 168°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

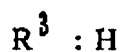
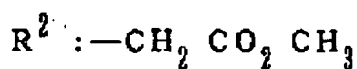
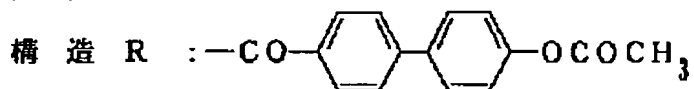
【0717】

[0717]

【表 119】

[Table 119]

実施例 128



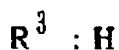
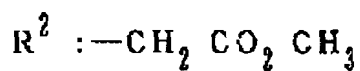
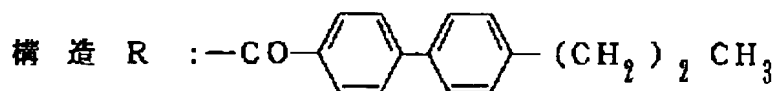
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 186-188℃

形態 : 遊離

実施例 129



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 120℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

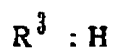
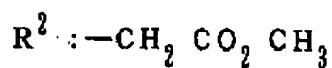
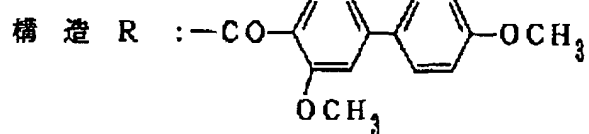
【0718】

[0718]

【表 120】

[Table 120]

実施例 130

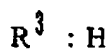
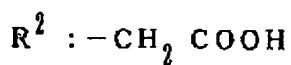
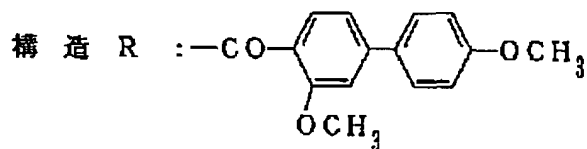


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 74)

形態 : 遊離

実施例 131



結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 109-111℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

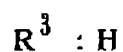
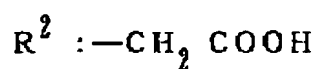
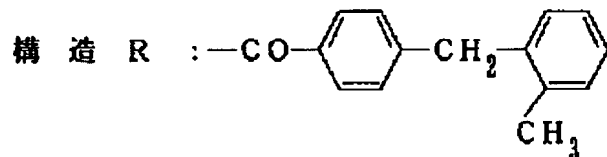
【0719】

[0719]

【表 121】

[Table 121]

実施例 132

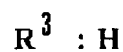
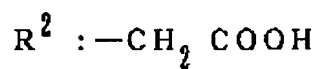
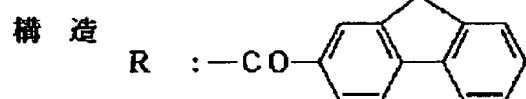


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 75)

形態 : 遊離

実施例 133



結晶形 : 黄色針状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 202-203℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

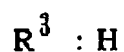
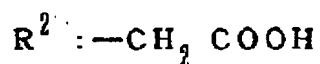
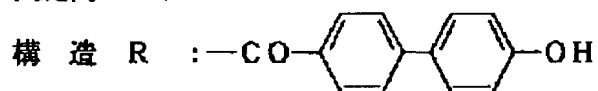
【0720】

[0720]

【表 122】

[Table 122]

実施例 134



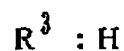
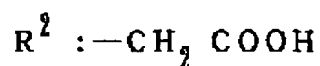
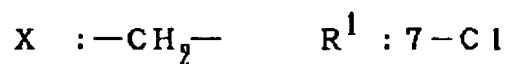
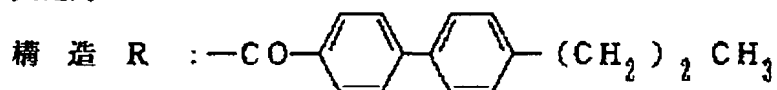
結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 235℃

形態 : 遊離

実施例 135



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 176℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

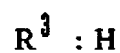
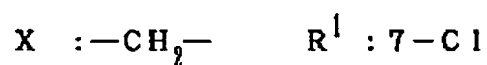
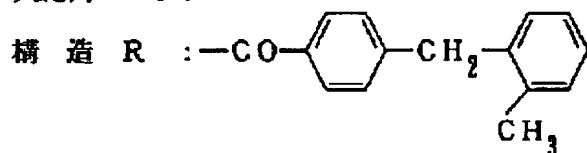
【0721】

[0721]

【表 123】

[Table 123]

実施例 136

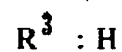
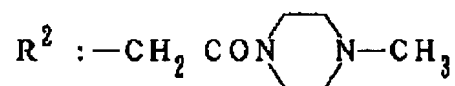
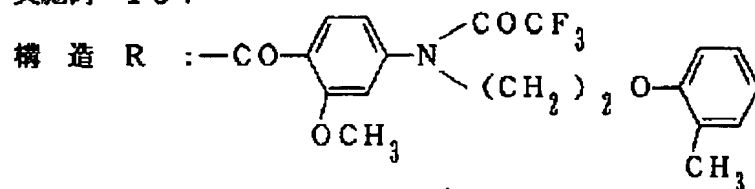


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 76)

形態 : 遊離

実施例 137



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 77)

形態 : 遊離

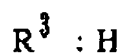
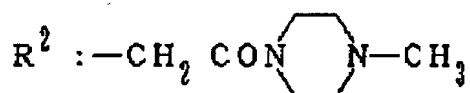
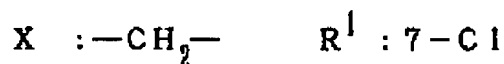
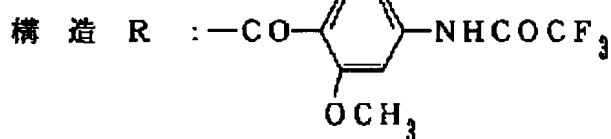
[0722]

[0722]

【表 124】

[Table 124]

実施例 138



結 晶 形 : 白色粉末状

NMRスペクトル : 78)

形 態 : 遊 離

[0723]

NMR 1)(実施例 9)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.78-5.25(23H, m), 2.96 及び 3.20(全 3H,s), 3.71(3H,s), 3.83(3 H,s), 6.51-7.18(6H,m)。

[0724]

NMR 2)(実施例 10)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.25(14H, m), 2.30-2.55(1H,m), 2.60-3.30(3H,m), 3.50-3.90(1H,m), 4.45-4.60 及び 5.10-5.30(1H,m), 6.15 (1H,brs), 6.59(1H,d,J=8.3Hz), 6.85-7.00(3H,m), 7.10-7.35(3H,m)。

[0725]

NMR 3)(実施例 11)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-3.40(22H, m), 2.21 及び 2.34(3H,s), 3.50-3.90(5H,m), 4.4

[0723]

nmr 1)(Working Example 9)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.78-5.25 (23 H, m), 2.96 and 3.20 (All 3 H, s), 3.71 (3 H, s), 3.83 (3 H, s), 6.51 - 7.18(6 H, m).

[0724]

nmr 2)(Working Example 10)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.20-2.25 (14 H, m), 2.30 - 2.55 (1 H, m), 2.60 - 3.30 (3 H, m), 3.50 - 3.90 (1 H, m), 4.45 - 4.60 and 5.10 - 5.30 (1 H, m), 6.15 (1 H, brs), 6.59 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.85 - 7.00 (3 H, m), 7.10- 7.35 (3 H, m).

[0725]

nmr 3)(Working Example 11)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.20-3.40 (22 H, m), 2.21 and 2.34 (3 H, s), 3.50 - 3.90

0.4-6.0 及び 5.05-5.20(1H,m), 6.50-6.60(1H,m), 6.85-6.95(1H,m), 7.00-7.15(3H,m), 7.25-7.50(2H,m)。

【0726】

NMR 4)(実施例 12)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.82,1.02 及び 1.08(全 6H,各 t,J=7Hz), 1.2-4.0,4.35-4.65 及び 4.95-5.24(全 27H,m), 6.35-6.70(1H,m), 6.75-7.65(10H,m)。

【0727】

NMR 5)(実施例 15)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.71-2.24(11H,m), 2.25-5.17(21H,m), 5.71-7.54(9H,m)。

【0728】

NMR 6)(実施例 16)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.78-5.16(32H,m), 5.79-7.51(10H,m)。

【0729】

NMR 7)(実施例 21)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.00-5.26(17H,m), 2.28 及び 2.34(各 3H,各 s), 6.54-6.75(1H,m), 6.89-7.93(8H,m), 8.48-8.74(1H,m)。

【0730】

NMR 8)(実施例 22)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.85,1.00 及び 1.07(全 6H,各 t,J=7Hz), 1.1-4.0,4.35-4.65,4.65-4.95 及び 4.95-5.25(全 27H,m), 6.4-6.65(1H,m), 6.75-7.65(10H,m)。

【0731】

NMR 9)(実施例 23)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:2.15(3H,s), 2.40(3H,s), 2.71-4.00(7H,m), 4.01-4.39(1H,m), 4.69-5.01(1H,m), 6.42-7.55(10H,m)。

【0732】

NMR 10)(実施例 25)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.03-2.08(4H,m), 1.22(6H,t,J=7.1Hz), 2.62-4.95(22H,m), 6.23-7.42(6H,m), 10.45-11.47(1H,m)。

(5 H, m), 4.40 - 4.60 and 5.05 - 5.20 (1 H, m), 6.50 - 6.60 (1 H, m), 6.85 - 6.95 (1 H, m), 7.00 - 7.15 (3 H, m), 7.25 - 7.50 (2 H, m)。

【0726】

nmr 4) (Working Example 12)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.82, 1.02 and 1.08 (All 6 H, each t, J=7Hz), 1.2 - 4.0 and 4.35 - 4.65 and 4.95 - 5.24 (All 27 H, m), 6.35 - 6.70 (1 H, m), 6.75 - 7.65 (10 H, m)。

【0727】

nmr 5) (Working Example 15)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.71-2.24 (11 H, m), 2.25 - 5.17 (21 H, m), 5.71 - 7.54 (9 H, m)。

【0728】

nmr 6) (Working Example 16)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.78-5.16 (32 H, m), 5.79 - 7.51 (10 H, m)。

【0729】

nmr 7) (Working Example 21)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.00-5.26 (17 H, m), 2.28 and 2.34 (Each 3 H, each s), 6.54 - 6.75 (1 H, m), 6.89 - 7.93(8 H, m), 8.48 - 8.74 (1 H, m)。

【0730】

nmr 8) (Working Example 22)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.85, 1.00 and 1.07 (All 6 H, each t, J=7Hz), 1.1 - 4.0 and 4.35 - 4.65 and 4.65 - 4.95 and 4.95 - 5.25 (All 27 H, m), 6.4 - 6.65 (1 H, m), 6.75 - 7.65 (10 H, m)。

【0731】

nmr 9) (Working Example 23)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :2.15 (3 H, s), 2.40 (3 H, s), 2.71 - 4.00 (7 H, m), 4.01 - 4.39 (1 H, m), 4.69 - 5.01 (1 H, m), 6.42 - 7.55 (10 H, m)。

【0732】

nmr 10) (Working Example 25)

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆); de ppm :1.03-2.08 (4 H, m), 1.22 (6 H, t, J=7.1Hz), 2.62 - 4.95 (22 H, m), 6.23 - 7.42 (6 H, m), 10.45 - 11.47 (1 H, m)。

【0733】

NMR 11)(实施例 26)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.34-1.72(1H, m), 1.81-2.25(3H,m), 2.57-3.18(3H,m), 3.70(3 H,s), 3.82(3H,s), 4.35-5.22(1H,m), 6.53-6.69(2 H,m), 6.73(1H,dd,J=8.4Hz,1.8Hz), 6.82(1H,d,J=1.8Hz), 6.91(1H,dd,J=8.4Hz,2.4Hz), 7.24(1H, d,J=2.4Hz)。

【0734】

NMR 12)(实施例 27)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.32-2.14(4H, m), 2.57-3.20(3H,m), 3.52(3H,s), 3.73(3H,s), 4.82-5.05(1H,m), 6.16(1H,d,J=2.2Hz), 6.35(1H, dd,J=8.4Hz,2.2Hz), 6.64(1H,d,J=8.2Hz), 6.81(1 H,dd,J=8.4Hz,2.4Hz), 7.06-7.24(2H,m)。

【0735】

NMR 13)(实施例 28)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.78-2.13(1 3H,m), 2.65-5.12(13H,m), 3.17 及び 3.33(全 3H, s), 3.95(2H,q,J=6.8Hz), 6.55-7.58(7H,m), 10.53 -11.48(1H,m)。

【0736】

NMR 14)(实施例 29)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.98-2.06(1 3H,m), 2.61-4.88(21H,m), 6.18-7.45(6H,m), 1 0.42-11.52(1H,m)。

【0737】

NMR 15)(实施例 30)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.92-1.95(7 H,m), 2.34-4.43(14H,m), 2.41 及び 2.53(全 3H, s), 2.77(6H,s), 6.52-7.38(6H,m), 10.58-11.57(2 H,m)。

【0738】

NMR 16)(实施例 31)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.96-2.03(4 H,m), 2.33-4.62(13H,m), 2.41 及び 2.53(全 3H, s), 2.76(3H,s), 3.34(3H,s), 6.52-7.48(6H,m), 1 1.48(1H,brs)。

【0739】

NMR 17)(实施例 32)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.96-4.87(2 2H,m), 2.40 及び 2.53(全 3H,s), 2.73 及び 2.77 (全 3H,s), 6.51-7.45(6H,m), 11.36(1H,brs)。

【0733】

nmr 11)(Working Example 2 6)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.34-1.72 (1 H, m), 1.81 - 2.25 (3 H, m), 2.57 - 3.18 (3 H, m), 3.70 (3 H, s), 3.82(3 H, s), 4.35 - 5.22 (1 H, m), 6.53 - 6.69 (2 H, m), 6.73 (1 H, dd, J=8.4Hz , 1.8Hz), 6.82 (1 H, d, J=1.8Hz), 6.91 (1 H, dd, J=8.4Hz , 2.4Hz), 7.24(1 H, d, J=2.4Hz) .

【0734】

nmr 12)(Working Example 2 7)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.32-2.14 (4 H, m), 2.57 - 3.20 (3 H, m), 3.52 (3 H, s), 3.73 (3 H, s), 4.82 - 5.05(1 H, m), 6.16 (1 H, d, J=2.2Hz), 6.35 (1 H, dd, J=8.4Hz , 2.2Hz), 6.64 (1 H, d, J=8.2Hz), 6.81 (1 H, dd, J=8.4Hz , 2.4Hz), 7.06 - 7.24 (2 H, m).

【0735】

nmr 13)(Working Example 2 8)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.78-2.13 (13 H, m), 2.65 - 5.12 (13 H, m), 3.17 and 3.33 (All 3 H, s), 3.95 (2 H, q, J=6.8Hz), 6.55- 7.58 (7 H, m), 10.53 - 11.48 (1 H, m).

【0736】

nmr 14)(Working Example 2 9)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.98-2.06 (13 H, m), 2.61 - 4.88 (21 H, m), 6.18 - 7.45 (6 H, m), 10.42 - 11.52(1 H, m).

【0737】

nmr 15)(Working Example 30)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.92-1.95 (7 H, m), 2.34 - 4.43 (14 H, m), 2.41 and 2.53 (All 3 H, s), 2.77 (6 H, s), 6.52- 7.38 (6 H, m), 10.58 - 11.57 (2 H, m).

【0738】

nmr 16)(Working Example 31)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.96-2.03 (4 H, m), 2.33 - 4.62 (13 H, m), 2.41 and 2.53 (All 3 H, s), 2.76 (3 H, s), 3.34(3 H, s), 6.52 - 7.48 (6 H, m), 11.48 (1 H, brs).

【0739】

nmr 17)(Working Example 32)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.96-4.87 (22 H, m), 2.40 and 2.53 (All 3 H, s), 2.73 and 2.77 (All 3 H, s), 6.51 - 7.45(6 H,

(全 3H,s), 6.51-7.45(6H,m), 11.36(1H,brs)。

【0740】

NMR 18)(実施例 34)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.17-5.24(22H, m), 6.41-7.58(12H,m)。

【0741】

NMR 19)(実施例 35)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-5.24(26H, m), 6.32-7.69(11H,m)。

【0742】

NMR 20)(実施例 36)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.74-5.24(32H, m), 6.28-7.70(11H,m)。

【0743】

NMR 21)(実施例 38)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-4.0,4.35-4.65,4.65-5.0 及び 5.0-5.25(全 27H,m), 6.4-6.65(1 H,m), 6.75-7.6(10H,m)。

【0744】

NMR 22)(実施例 39)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-4.0,4.35-4.7 及び 4.95-5.25(全 28H,m), 5.7-6.0(1H,m), 6.4-6.65(1H,m), 6.75-7.6(10H,m)。

【0745】

NMR 23)(実施例 40)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-4.65 及び 4.95-5.25(全 25H,m), 6.35-6.65 及び 6.65-8.2(全 11H,m)。

【0746】

NMR 24)(実施例 46)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-3.95,4.45-4.65,4.7-4.9 及び 5.0-5.25(全 27H,m), 6.4-6.65 及び 6.75-7.6(全 11H,m)。

【0747】

NMR 25)(実施例 47)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.12-2.06(20H,m), 2.66-4.40(21H,m), 3.18 及び 3.33(全 3H, s), 6.53-7.41(7H,m), 10.67-11.53(2H,m)。

【0748】

m), 11.36 (1 H, brs).

【0740】

nmr 18) (Working Example 34)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.17-5.24 (22 H, m), 6.41 - 7.58 (12 H, m).

【0741】

nmr 19) (Working Example 35)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.10-5.24 (26 H, m), 6.32 - 7.69 (11 H, m).

【0742】

nmr 20) (Working Example 36)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); de ppm :0.74-5.24 (32 H, m), 6.28 - 7.70 (11 H, m).

【0743】

nmr 21) (Working Example 38)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.1- 4.0, 4.35-4.65, 4.65-5.0 and 5.0 - 5.25 (All 27 H, m), 6.4 - 6.65 (1 H, m), 6.75 - 7.6 (10 H, m).

【0744】

nmr 22) (Working Example 39)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.1- 4.0, 4.35-4.7 and 4.95 - 5.25 (All 28 H, m), 5.7 - 6.0 (1 H, m), 6.4 - 6.65 (1 H, m), 6.75 - 7.6 (10 H, m).

【0745】

nmr 23) (Working Example 40)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.2- 4.65 and 4.95 - 5.25 (All 25 H, m), 6.35 - 6.65 and 6.65 - 8.2 (All 11 H, m).

【0746】

nmr 24) (Working Example 46)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); de ppm :1.2- 3.95, 4.45-4.65, 4.7-4.9 and 5.0 - 5.25 (All 27 H, m), 6.4 - 6.65 and 6.75 - 7.6 (All 11 H, m).

【0747】

nmr 25) (Working Example 47)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆); de ppm :1.12-2.06 (20 H, m), 2.66 - 4.40 (21 H, m), 3.18 and 3.33 (All 3 H, s), 6.53 - 7.41 (7 H, m), 10.67 - 11.53 (2 H, m).

【0748】

NMR 26)(実施例 48)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-3.95,4.45-4.65 及び 4.95-5.25(全 29H,m), 5.7-6.05(1H,m), 6.35-6.65(1H,m), 6.75-7.65(9H,m)。

【0749】

NMR 27)(実施例 49)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.22-2.34(4H,m), 2.42-3.42(3H,m), 2.82(3H,s), 3.01(3H,s), 3.68(3H,s), 4.81-5.41(1H,m), 5.08(2H,s), 6.42-7.12(5H,m), 7.13-7.72(5H,m)。

【0750】

NMR 28)(実施例 50)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:0.90-2.25(4H,m), 1.17(6H,t,J=7.10Hz), 2.40-3.90(17H,m), 4.63-5.17(1H,m), 4.98(2H,s), 6.52-7.21(5H,m), 7.24-7.65(5H,m), 10.16-10.70(1H,m)。

【0751】

NMR 29)(実施例 59)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.8-1.2(6H,m), 1.2-4.0,4.4-4.65 及び 5.0-5.25(20H,m), 6.45-6.65(1H,m), 6.6-7.75(12H,m)。

【0752】

NMR 30)(実施例 60)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.8-1.15(6H,m), 1.15-3.95,4.35-4.65 及び 4.95-5.25(全 20H,m),2.96,3.17(各 s), 6.4-7.6(13H,m)。

【0753】

NMR 31)(実施例 61)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.06-2.41(7H,m), 2.31(3H,s), 2.51-4.38(16H,m), 4.51-4.92(2H,m), 6.53-7.52(10H,m), 12.52-12.94(1H,m)。

【0754】

NMR 32)(実施例 62)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.26(5H,m), 2.02(3H,s), 2.58-5.29(7H,m), 3.69(3H,s), 6.49-7.45(10H,m)。

【0755】

NMR 33)(実施例 63)

nmr 26) (Working Example 48)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.1- 3.95, 4.45-4.65 and 4.95 - 5.25 (All 29 H, m), 5.7 - 6.05 (1 H, m), 6.35 - 6.65 (1 H, m),6.75 - 7.65 (9 H, m).

【0749】

nmr 27) (Working Example 49)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.22-2.34 (4 H, m), 2.42 - 3.42 (3 H, m), 2.82 (3 H, s), 3.01 (3 H, s), 3.68 (3 H, s), 4.81- 5.41 (1 H, m), 5.08 (2 H, s), 6.42 - 7.12 (5 H, m), 7.13 - 7.72 (5 H, m).

【0750】

nmr 28) (Working Example 50)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :0.90-2.25 (4 H, m), 1.17 (6 H, t, J=7.10Hz), 2.40 - 3.90 (17 H, m), 4.63 - 5.17 (1 H, m), 4.98(2 H, s), 6.52 - 7.21 (5 H, m), 7.24 - 7.65 (5 H, m), 10.16 - 10.70 (1 H, m).

【0751】

nmr 29) (Working Example 59)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.8-1.2 (6 H, m), 1.2 - 4.04-4 - 4.65 and 5.0 - 5.25 (20 H, m), 6.45 -6.65 (1 H, m), 6.6 - 7.75 (12 H, m).

【0752】

nmr 30) (Working Example 60)

All 20 H, m, 2.96, 3.17 (Each s), 6.4 - 7.6 (13 H, m).
¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.8-1.15 (6 H, m), 1.15 - 3.95 and 4.35 - 4.65 and 4.95 - 5.25

【0753】

nmr 31) (Working Example 61)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.06-2.41 (7 H, m), 2.31 (3 H, s), 2.51 - 4.38 (16 H, m), 4.51 - 4.92 (2 H, m), 6.53 -7.52 (10 H, m), 12.52 - 12.94 (1 H, m).

【0754】

nmr 32) (Working Example 62)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.13-2.26 (5 H, m), 2.02 (3 H, s), 2.58 - 5.29 (7 H, m), 3.69 (3 H, s), 6.49 - 7.45(10 H, m).

【0755】

nmr 33) (Working Example 63)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-5.29(17H, m), 2.16(3H,s), 2.34(3H,s), 6.47-7.62(11H,m)。

【0756】

NMR 34)(実施例 64)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.70-1.19(6H, m), 1.20-5.25(20H,m), 2.16(3H,m), 6.48-7.62(11H,m)。

【0757】

NMR 35)(実施例 65)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.02-5.28(23H, m), 2.02(3H,s), 6.52-7.50(10H,m), 11.68-12.41(1H,m)。

【0758】

NMR 36)(実施例 66)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.04-5.32(29H, m), 2.02(3H,s), 6.48-7.51(10H,m), 11.87-12.28(1H,m)。

NMR 37)(実施例 69)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.46-2.41(4H, m), 2.14(3H,s), 2.68-2.98(1H,m), 3.27-3.83(4H,m), 4.68-5.27(2H,m), 6.47-7.54(9H,m), 7.60(1H,d,J=2.16Hz)。

【0759】

NMR 38)(実施例 71)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.86-5.20(32H, m), 6.51-7.52(10H,m), 11.62-12.24(1H,m)。

【0760】

NMR 39)(実施例 73)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.28-2.28(4H, m), 2.14(3H,s), 2.58-2.92(2H,m), 2.93-3.28(1H, m), 3.58(3H,s), 4.82-5.12(1H,m), 6.56(1H,s), 6.65-6.96(3H,m), 6.97-7.48(6H,m)。

【0761】

NMR 40)(実施例 80)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.21-2.25(4H, m), 2.01(3H,s), 2.26-3.20(3H,m), 3.59(3H,s), 4.86-5.22(1H,m), 6.42-7.45(10H,m)。

【0762】

NMR 41)(実施例 84)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-5.29 (17 H, m), 2.16 (3 H, s), 2.34 (3 H, s), 6.47 - 7.62 (11 H, m).

【0756】

nmr 34) (Working Example 64)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.70-1.19 (6 H, m), 1.20 - 5.25 (20 H, m), 2.16 (3 H, m), 6.48 - 7.62 (11 H, m).

【0757】

nmr 35) (Working Example 65)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.02-5.28 (23 H, m), 2.02 (3 H, s), 6.52 - 7.50 (10 H, m), 11.68 - 12.41 (1 H, m).

【0758】

nmr 36) (Working Example 66)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.04-5.32 (29 H, m), 2.02 (3 H, s), 6.48 - 7.51 (10 H, m), 11.87 - 12.28 (1 H, m).

nmr 37) (Working Example 69)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.46-2.41 (4 H, m), 2.14 (3 H, s), 2.68 - 2.98 (1 H, m), 3.27 - 3.83 (4 H, m), 4.68 - 5.27 (2 H, m), 6.47 - 7.54 (9 H, m), 7.60 (1 H, d, J=2.16Hz).

【0759】

nmr 38) (Working Example 71)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.86-5.20 (32 H, m), 6.51 - 7.52 (10 H, m), 11.62 - 12.24 (1 H, m).

【0760】

nmr 39) (Working Example 73)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.28-2.28 (4 H, m), 2.14 (3 H, s) 2.58 - 2.92 (2 H, m), 2.93 - 3.28 (1 H, m), 3.58(3 H, s), 4.82 - 5.12 (1 H, m), 6.56 (1 H, s), 6.65 - 6.96 (3 H, m), 6.97 - 7.48 (6 H, m).

【0761】

nmr 40) (Working Example 80)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.21-2.25 (4 H, m), 2.01 (3 H, s), 2.26 - 3.20 (3 H, m), 3.59 (3 H, s), 4.86 - 5.22(1 H, m), 6.42 - 7.45 (10 H, m).

【0762】

nmr 41) (Working Example 84)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-4.0,4.35-4.65 及び 5.0-5.25(全 20H,m,2.34(s)), 6.45-6.7(1 H,m), 6.91(1H,dd,J=2Hz,8Hz), 7.05(1H,d,J=2Hz), 7.15-7.7(9H,m)。

【0763】

NMR 42)(実施例 85)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-3.95,4.35-4.65,5.0-5.25(全 20H,m,2.33(s)), 6.4-7.55(12H,m,6.59(d,J=8Hz), 6.79(d,J=8.5Hz))。

【0764】

NMR 43)(実施例 86)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.1-2.2(7H,m), 2.45-3.3,3.35-3.9,4.0-4.35,4.35-4.65 及び 4.95-5.35(全 9H,m,5.09(s)), 6.45-6.65(1H,m), 6.77(2 H,d,J=8.5Hz), 6.92(1H,dd,J=2Hz,8.5Hz), 7.05-7.6(7H,m)。

【0765】

NMR 44)(実施例 87)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.2(4H,m), 2.5-3.3,3.35-3.9,4.3-4.6 及び 4.9-5.3(全 7H,m,5.06(s)), 4.45-6.65(1H,m), 6.74(2H,d,J=8.5Hz), 6.93(1H,dd,J=2Hz,8.5Hz), 7.12(1H,d,J=2Hz), 7.12-7.55(6H,m)。

【0766】

NMR 45)(実施例 88)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.85,2.85-4.0,4.35-4.65 及び 4.9-5.35(全 22H,2.33,5.10(各 s)), 6.4-6.65(1H,m), 6.80(2H,d,J=8.5Hz), 6.92(1H,dd,J=2Hz,8.5Hz), 7.04(1H,d,J=2Hz), 7.04-7.6(6H,m)。

【0767】

NMR 46)(実施例 89)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.20-2.45(7H,m,2.27(s)), 2.5-3.1,3.1-3.4,3.4-3.9,4.35-4.65 及び 5.02-5.30(全 8H,m,3.72(s)), 6.56(1H,d,J=8.3Hz), 6.92(1H,dd,J=2.3Hz,8.4Hz), 7.10(1H,d,J=2.2 Hz), 7.10-7.71(8H,m)。

【0768】

NMR 47)(実施例 90)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.23-2.47(4H,m), 2.26(3H,s), 2.6-3.05(2H,m), 3.10-3.43,3.48-3.90,4.35-4.62 及び 5.05-5.29(全 3H,m), 6.56(1 H,d,J=8.3Hz), 6.90(1H,dd,J=2.2Hz,8.3Hz), 7.08(1H,d,J=2.2Hz), 7.12-7.55(6H,m), 7.61(2H,d,J=

All 20 H, m, 2.34 (s), 6.45 - 6.7 (1 H, m), 6.91 (1 H, dd, J=2Hz, 8Hz), 7.05 (1 H, d, J=2Hz), 7.15 - 7.7 (9 H, m). ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.1- 4.0, 4.35-4.65 and 5.0 - 5.25

【0763】

nmr 42) (Working Example 85)

All 20 H, m, 2.33 (s), 6.4 - 7.55 {12 H, m, 6.59 (d, J=8Hz), 6.79 (d, J=8.5Hz) }. ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.2- 3.95, 4.35-4.65, 5.0-5.25

【0764】

nmr 43) (Working Example 86)

All 9 H, m, 5.09 (s), 6.45 - 6.65 (1 H, m), 6.77 (2 H, d, J=8.5Hz), 6.92 (1 H, dd, J=2Hz, 8.5Hz), 7.05 - 7.6 (7 H, m). ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.1- 2.2 (7 H, m), 2.45 - 3.3 and 3.35 - 3.94.0 - 4.35 and 4.35 - 4.65 and 4.95 - 5.35

【0765】

nmr 44) (Working Example 87)

All 7 H, m, 5.06 (s), 4.45 - 6.65 (1 H, m), 6.74 (2 H, d, J=8.5Hz), 6.93 (1 H, dd, J=2Hz, 8.5Hz), 7.12 (1 H, d, J=2Hz), 7.12 - 7.55 (6 H, m). ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.15-2.2 (4 H, m), 2.5 - 3.3 and 3.35 - 3.94.3 - 4.6 and 4.9 - 5.3

【0766】

nmr 45) (Working Example 88)

All 22 H, 2.33, 5.10 (Each s), 6.4 - 6.65 (1 H, m), 6.80 (2 H, d, J=8.5Hz), 6.92 (1 H, dd, J=2Hz, 8.5Hz), 7.04 (1 H, d, J=2Hz), 7.04 - 7.6 (6 H, m). ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.15-2.85, 2.85-4.0, 4.35-4.65 and 4.9 - 5.35

【0767】

nmr 46) (Working Example 89)

All 8 H, m, 3.72 (s), 6.56 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.92 (1 H, dd, J=2.3Hz, 8.4Hz), 7.10 (1 H, d, J=2.2Hz), 7.10 - 7.71 (8 H, m). 7 H, m, 2.27 (s), 2.5 - 3.13.1 - 3.43.4 - 3.9 and 4.35 - 4.65 and 5.02 - 5.30 ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.20-2.45

【0768】

nmr 47) (Working Example 90)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃);de ppm :1.23-2.47 (4 H, m), 2.26 (3 H, s), 2.6 - 3.05 (2 H, m), 3.10 - 3.43 and 3.48 - 3.90 and 4.35 - 4.62 and 5.05 - 5.29 (All 3 H, m), 6.56 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.90 (1 H, dd, J=2.2Hz, 8.3Hz), 7.08 (1 H, d, J=2.2Hz), 7.12 - 7.55 (6 H,

8.5Hz)。

【0769】

NMR 48)(実施例 92)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.84,1.05 及び 1.08(全 6H,各 t,J=7Hz), 1.2-4.0,4.1-4.7 及び 4.8-5.3(全 25H,m,2.24(s)), 2.61(q,J=7Hz), 2.99,3.19(各 s), 6.4-7.7(11H,m,6.55(d,J=8Hz))。

【0770】

NMR 49)(実施例 93)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.90,0.97 及び 1.07(全 6H,各 t,J=7Hz), 1.15-4.02,4.38-4.65 及び 4.95-5.25(全 23H,m,2.26,3.18(各 s)), 6.54(1H,d,J=8.3Hz), 6.77-7.70(10H,m)。

【0771】

NMR 50)(実施例 94)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.82,1.00 及び 1.07(全 6H,各 t,J=7Hz), 1.15-3.98,4.47-4.68,4.95-5.22 及び 5.75-6.10(全 25H,m), 6.40-6.68 及び 6.73-7.68(全 11H,m)。

【0772】

NMR 51)(実施例 96)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.4(4H,m), 2.20(3H,s), 2.5-3.35,3.4-3.9,4.25-4.6 及び 4.9-6.2(全 8H,m,4.22(s)), 6.4-6.65(1H,m), 6.75-6.95(1H,m), 6.95-7.35(5H,m), 7.42(2H,d,J=8.5Hz), 7.81(2H,d,J=8.5Hz)。

【0773】

NMR 52)(実施例 97)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.2-2.3,2.5-3.4,3.5-4.3,4.35-4.7 及び 5.05-5.35(全 12H,3.75(s)), 6.4-6.7(1H,m), 6.93(1H,dd,J=2Hz,8.5Hz), 7.13(1H,d,J=2Hz), 7.2-7.8(9H,m)。

【0774】

NMR 53)(実施例 98)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.85,1.03 及び 1.08(全 6H,各 t,J=7Hz), 1.2-4.0,4.3-4.65 及び 4.9-5.3(全 22H,2.99,3.19,5.10(各 s)), 6.45-7.6(11H,m)。

【0775】

NMR 54)(実施例 99)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.27(3H,t,J=7.

m), 7.61(2 H, d, J=8.5Hz)。

【0769】

nmr 48)(Working Example 92)

11 H, m, 6.55 (d, J=8Hz). All 25 H, m, 2.24 (s), 2.61 (q, J=7Hz), 2.99 and 3.19 (Each s), 6.4 - 7.7
¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.84, 1.05 and 1.08 (All 6 H, each t, J=7Hz), 1.2 - 4.04.1 - 4.7 and 4.8 - 5.3

【0770】

nmr 49)(Working Example 93)

All 23 H, m, 2.26, 3.18 (Each s), 6.54 (1 H, d, J=8.3Hz), 6.77 - 7.70 (10 H, m). ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.90, 0.97 and 1 and 07 (All 6 H, each t, J=7Hz), 1.15 - 4.02 and 4.38 - 4.65 and 4.95 - 5.25

【0771】

nmr 50)(Working Example 94)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.82, 1.00 and 1.07 (All 6 H, each t, J=7Hz), 1.15 - 3.98 and 4.47 - 4.68 and 4.95 - 5.22 and 5.75 - 6.10 (All 25 H, m), 6.40 - 6.68 and 6.73 - 7.68 (All 11 H, m).

【0772】

nmr 51)(Working Example 96)

All 8 H, m, 4.22 (s), 6.4 - 6.65 (1 H, m), 6.75 - 6.95 (1 H, m), 6.95 - 7.35 (5 H, m), 7.42 (2 H, d, J=8.5Hz), 7.81 (2 H, d, J=8.5Hz). ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.2- 2.4 (4 H, m), 2.20 (3 H, s), 2.5 - 3.35.4 - 3.9 and 4.25 - 4.6 and 4.9 - 6.2

【0773】

nmr 52)(Working Example 97)

All 12 H, 3.75 (s), 6.4 - 6.7 (1 H, m), 6.93 (1 H, dd, J=2Hz, 8.5Hz), 7.13 (1 H, d, J=2Hz), 7.2 - 7.8 (9 H, m). ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :1.2- 2.3, 2.5-3.4, 3.5-4.3, 4.35-4.7 and 5.05 - 5.35

【0774】

nmr 53)(Working Example 98)

All 22 H, 2.99, 3.19, 5.10 (Each s), 6.45 - 7.6 (11 H, m). ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de ppm :0.85, 1.03 and 1.08 (All 6 H, each t, J=7Hz), 1.2 - 4.04.3 - 4.65 and 4.9 - 5.3

【0775】

nmr 54)(Working Example 99)

¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); de

1Hz), 1.20-2.20(14H,m), 2.30-2.50(1H,m), 2.60-3.05(3H,m), 3.10-3.35(1H,m), 4.10-4.40(2H,m), 4.45-4.65(1H,m), 6.57(1H,d,J=8.4Hz), 6.96(1H,d,J=8.1Hz), 7.00(2H,d,J=8.0Hz), 7.10-7.35(3H,m)。

【0776】

NMR 55)(実施例 100)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-2.41(5H,m), 1.25(3H,t,J=7.10Hz), 2.16(3H,s), 2.54-5.32(6H,m), 6.48-7.54(11H,m)。

【0777】

NMR 56)(実施例 101)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-2.36(5H,m), 2.26(3H,s), 2.51-5.35(4H,m), 6.45-7.50(11H,m), 8.65-13.90(1H,m)。

【0778】

NMR 57)(実施例 102)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.39(5H,m), 2.57-3.05(2H,m), 3.09-5.28(2H,m), 3.67,3.72 及び 3.82(各 3H,各 s), 6.48-7.81(10H,m)。

【0779】

NMR 58)(実施例 103)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.14-2.26(4H,m), 2.01(3H,s), 2.52-3.10(2H,m), 3.01-5.28(3H,m), 3.61(3H,s), 6.48-7.88(10H,m), 8.50-13.9(1H,m)。

【0780】

NMR 59)(実施例 104)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.18-2.32(4H,m), 2.57-3.09(2H,m), 3.10-5.29(3H,m), 3.66 及び 3.81(各 3H,各 s), 6.45-7.80(10H,m), 8.03-13.80(1H,m)。

【0781】

NMR 60)(実施例 105)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.13-2.37(4H,m), 2.14(3H,s), 2.54-2.97(2H,m), 2.98-5.20(3H,m), 3.68 及び 3.74(各 3H,各 s), 6.50-7.52(10H,m)。

【0782】

NMR 61)(実施例 106)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.41-4.06(5H,

ppm :1.27 (3 H, t, J=7.1Hz), 1.20 - 2.20 (14 H, m), 2.30 - 2.50 (1 H, m), 2.60 - 3.05 (3 H, m), 3.10 - 3.35 (1 H, m), 4.10 - 4.40 (2 H, m), 4.45 - 4.65 (1 H, m), 6.57 (1 H, d, J=8.4Hz), 6.96 (1 H, d, J=8.1Hz), 7.00(2 H, d, J=8.0Hz), 7.10 - 7.35 (3 H, m)。

【0776】

nmr 55) (Working Example 100)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.08-2.41 (5 H, m), 1.25 (3 H, t, J=7.10Hz), 2.16 (3 H, s), 2.54 - 5.32 (6 H, m), 6.48 - 7.54(11 H, m)。

【0777】

nmr 56) (Working Example 101)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.14-2.36 (5 H, m), 2.26 (3 H, s), 2.51 - 5.35 (4 H, m), 6.45 - 7.50 (11 H, m), 8.65 -13.90 (1 H, m)。

【0778】

nmr 57) (Working Example 102)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-2.39 (5 H, m), 2.57 - 3.05 (2 H, m), 3.09 - 5.28 (2 H, m), 3.67 and 3.72 and 3.82 (Each 3 H, each s), 6.48 - 7.81 (10 H, m)。

【0779】

nmr 58) (Working Example 103)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.14-2.26 (4 H, m), 2.01 (3 H, s), 2.52 - 3.10 (2 H, m), 3.01 - 5.28 (3 H, m), 3.61(3 H, s), 6.48 - 7.88 (10 H, m), 8.50 - 13.9 (1 H, m)。

【0780】

nmr 59) (Working Example 104)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.18-2.32 (4 H, m), 2.57 - 3.09 (2 H, m), 3.10 - 5.29 (3 H, m), 3.66 and 3.81(Each 3 H, each s), 6.45 - 7.80 (10 H, m), 8.03 - 13.80 (1 H, m)。

【0781】

nmr 60) (Working Example 105)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.13-2.37 (4 H, m), 2.14 (3 H, s), 2.54 - 2.97 (2 H, m), 2.98 - 5.20 (3 H, m), 3.68and 3.74 (Each 3 H, each s), 6.50 - 7.52 (10 H, m)。

【0782】

nmr 61) (Working Example 106)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de

m), 2.13(3H,s), 3.39(3H,s), 4.36-5.41(1H,m), 6.49(1H,s), 6.79(1H,d,J=8.44Hz), 6.88(1H,d,J=7.42Hz), 7.01-7.62(6H,m), 7.79(1H,d,J=2.24Hz)。

【0783】

NMR 62)(実施例 107)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-2.21(5H, m), 2.51-3.26(3H,m), 3.27-4.11(4H,m), 3.77(3H,s), 4.36-4.88(4H,m), 5.71-7.58(10H,m)。

【0784】

NMR 63)(実施例 108)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.06-2.21(4H, m), 2.49-5.23(11H,m), 3.73(3H,s), 5.78-7.50(9H,m)。

【0785】

NMR 64)(実施例 110)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.04-2.26(4H, m), 2.47-5.20(14H,m), 5.58-7.72(10H,m)。

【0786】

NMR 65)(実施例 111)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.31-1.69(1H, m), 1.70-2.24(3H,m), 2.55-3.20(3H,m), 4.88-5.20(1H,m), 5.03(2H,s), 6.51-7.51(16H,m)。

【0787】

NMR 66)(実施例 113)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.15-2.40(4H, m), 2.28(3H,s), 2.60-5.29(5H,m), 3.74(3H,s), 6.54-6.78(1H,m), 6.88-7.06(1H,m), 7.09-7.46(6H,m), 7.58-7.79(1H,m), 8.46-8.66(1H,m)。

【0788】

NMR 67)(実施例 116)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-2.30(4H, m), 2.49-5.29(5H,m), 3.70(3H,s), 3.87(2H,s), 6.41-7.75(12H,m)。

【0789】

NMR 68)(実施例 119)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:(CDCl₃) :1.21-2.31(4H,m), 2.60-5.27(5H,m), 3.75(3H,s), 6.41-6.63(1H,m), 6.80-7.53(2H,m), 7.48(2H,d,J=8.

ppm :1.41-4.06 (5 H, m), 2.13 (3 H, s), 3.39 (3 H, s), 4.36 - 5.41 (1 H, m), 6.49 (1 H, s), 6.79(1 H, d, J=8.44Hz), 6.88 (1 H, d, J=7.42Hz), 7.01 - 7.62 (6 H, m), 7.79 (1 H, d, J=2.24Hz).

【0783】

nmr 62) (Working Example 107)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-2.21 (5 H, m), 2.51 - 3.26 (3 H, m), 3.27 - 4.11 (4 H, m), 3.77 (3 H, s), 4.36 -4.88 (4 H, m), 5.71 - 7.58 (10 H, m).

【0784】

nmr 63) (Working Example 108)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.06-2.21 (4 H, m), 2.49 - 5.23 (11 H, m), 3.73 (3 H, s), 5.78 - 7.50 (9 H, m).

【0785】

nmr 64) (Working Example 110)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.04-2.26 (4 H, m), 2.47 - 5.20 (14 H, m), 5.58 - 7.72 (10 H, m).

【0786】

nmr 65) (Working Example 111)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.31 -1.69 (1 H, m), 1.70 - 2.24 (3 H, m), 2.55 - 3.20 (3 H, m), 4.88 - 5.20 (1 H, m),5.03 (2 H, s), 6.51 - 7.51 (16 H, m).

【0787】

nmr 66) (Working Example 113)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.15-2.40 (4 H, m), 2.28 (3 H, s), 2.60 - 5.29 (5 H, m), 3.74 (3 H, s), 6.54 - 6.78(1 H, m), 6.88 - 7.06 (1 H, m), 7.09 - 7.46 (6 H, m), 7.58 - 7.79 (1 H, m), 8.46 - 8.66 (1 H, m).

【0788】

nmr 67) (Working Example 116)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.10-2.30 (4 H, m), 2.49 - 5.29 (5 H, m), 3.70 (3 H, s), 3.87 (2 H, s), 6.41 - 7.75(12 H, m).

【0789】

nmr 68) (Working Example 119)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm : (CDCl₃); 1.21 - 2.31 (4 H, m), 2.60 - 5.27 (5 H, m), 3.75 (3 H, s), 6.41 -6.63 (1 H, m), 6.80

24Hz), 7.74(2H,d,J=8.42Hz), 9.99-10.02(1H, m)。

【0790】

NMR 69)(实施例 121)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.16-5.23(17H, m), 2.35(3H,s), 6.41-6.62(1H,m), 6.78-7.53(2 H,m), 7.61(2H,d,J=8.3Hz), 7.73(2H,d,J=8.3Hz), 9.94(1H,s)。

【0791】

NMR 70)(实施例 122)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.90-5.24(26H, m), 6.40-6.61(1H,m), 6.74-7.82(6H,m), 9.88-1 0.01(1H,m)。

【0792】

NMR 71)(实施例 123)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.94(3H,t,J=7. 3Hz), 0.78-5.25(26H,m), 6.48-7.82(11H,m), 12. 35-13.74(1H,m)。

【0793】

NMR 72)(实施例 125)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.85-5.23(28H, m), 6.37-7.80(10H,m), 12.29-13.40(1H,m)。

【0794】

NMR 73)(实施例 126)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.02-5.22(27H, m), 6.37-7.76(11H,m), 12.54-13.50(1H,m)。

【0795】

NMR 74)(实施例 130)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.08-2.37(4H, m), 2.51-5.45(11H,m), 3.83(3H,s), 6.34-7.62(1 0H,m)。

【0796】

NMR 75)(实施例 132)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.11-2.32(4H, m), 2.12(3H,s), 2.41-5.30(7H,m), 6.38-8.08(11 H,m), 8.91-13.00(1H,m)。

【0797】

NMR 76)(实施例 136)

- 7.53 (2 H, m), 7.48 (2 H, d, J=8.24Hz), 7.74 (2 H, d, J=8.42Hz), 9.99 - 10.02 (1 H, m)。

【0790】

nmr 69) (Working Example 121)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.16-5.23 (17 H, m), 2.35 (3 H, s), 6.41 - 6.62 (1 H, m), 6.78 - 7.53 (2 H, m), 7.61(2 H, d, J=8.3Hz), 7.73 (2 H, d, J=8.3Hz), 9.94 (1 H, s)。

【0791】

nmr 70) (Working Example 122)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.90-5.24 (26 H, m), 6.40 - 6.61 (1 H, m), 6.74 - 7.82 (6 H, m), 9.88 - 10.01(1 H, m)。

【0792】

nmr 71) (Working Example 123)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.94 (3 H, t, J=7.3Hz), 0.78 - 5.25 (26 H, m), 6.48 - 7.82 (11 H, m), 12.35 - 13.74(1 H, m)。

【0793】

nmr 72) (Working Example 125)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.85-5.23 (28 H, m), 6.37 - 7.80 (10 H, m), 12.29 - 13.40 (1 H, m)。

【0794】

nmr 73) (Working Example 126)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.02-5.22 (27 H, m), 6.37 - 7.76 (11 H, m), 12.54 - 13.50 (1 H, m)。

【0795】

nmr 74) (Working Example 130)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.08-2.37 (4 H, m), 2.51 - 5.45 (11 H, m), 3.83 (3 H, s), 6.34 - 7.62 (10 H, m)。

【0796】

nmr 75) (Working Example 132)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.11-2.32 (4 H, m), 2.12 (3 H, s), 2.41 - 5.30 (7 H, m), 6.38 - 8.08 (11 H, m), 8.91 -13.00 (1 H, m)。

【0797】

nmr 76) (Working Example 136)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03-2.36(4H, m), 2.13(3H,s)2.38-5.28(7H,m), 3.71(3H,s), 6.41-8.09(11H,m)。

【0798】

NMR 77)(実施例 137)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05-5.10(25H, m), 6.05-7.50(15H,m)。

【0799】

NMR 78)(実施例 138)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03-5.08(20H, m), 2.34(3H,s), 6.58-7.53(6H,m), 8.39-9.04(1 H,m)。

【0800】

NMR 79)(実施例 24)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:0.78-5.25(23H, m), 2.96 及び 3.20(全 3H,s), 3.71(3H,s), 3.83(3 H,s), 6.51-7.18(6H,m)。

【0801】

NMR 80)(実施例 52)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.12-2.36(4H, m), 2.20(3H,s), 2.56-4.00(4H,m), 4.25-5.41(1 H,m), 6.27-7.76(11H,m), 10.73-11.74(1H,m)。

【0802】

NMR 81)(実施例 54)

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.3-1.7(1H,m), 1.7-2.2(3H,m), 2.55-3.2(3H,m), 4.85-5.2(1H, m), 6.3-7.7(14H,m)。

【0803】

NMR 82)(実施例 55)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.07-2.04(1 0H,m), 2.58-3.98(18H,m), 4.13-4.36(1H,m), 4.73(2H,s), 6.61-7.43(10H,m), 7.87-8.01(1H,m), 9.21(1H,s), 10.32(1H,brs)。

【0804】

NMR 83)(実施例 56)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.05-2.06(1 0H,m), 2.43-3.80(15H,m), 4.17-4.40(1H,m), 4.73(2H,m), 6.63-7.48(10H,m), 7.84-7.98(1H,m), 8.56-8.71(1H,m), 9.22(1H,s), 10.34(1H,brs)。

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.03-2.36 (4 H, m), 2.13 (3 H, s) 2.38 - 5.28 (7 H, m), 3.71 (3 H, s), 6.41 - 8.09(11 H, m) .

【0798】

nmr 77) (Working Example 137)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05-5.10 (25 H, m), 6.05 - 7.50 (15 H, m) .

【0799】

nmr 78) (Working Example 138)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.03-5.08 (20 H, m), 2.34 (3 H, s), 6.58 - 7.53 (6 H, m), 8.39 - 9.04 (1 H, m) .

【0800】

nmr 79) (Working Example 24)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :0.78-5.25 (23 H, m), 2.96 and 3.20 (All 3 H, s), 3.71 (3 H, s), 3.83 (3 H, s), 6.51 - 7.18(6 H, m) .

【0801】

nmr 80) (Working Example 52)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.12-2.36 (4 H, m), 2.20 (3 H, s), 2.56 - 4.00 (4 H, m), 4.25 - 5.41 (1 H, m), 6.27 -7.76 (11 H, m), 10.73 - 11.74 (1 H, m) .

【0802】

nmr 81) (Working Example 54)

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.3- 1.7 (1 H, m), 1.7 - 2.2 (3 H, m), 2.55 - 3.2 (3 H, m), 4.85 - 5.2 (1 H, m), 6.3- 7.7 (14 H, m) .

【0803】

nmr 82) (Working Example 55)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.07-2.04 (10 H, m), 2.58 - 3.98 (18 H, m), 4.13 - 4.36 (1 H, m), 4.73 (2 H, s), 6.61 -7.43 (10 H, m), 7.87 - 8.01 (1 H, m), 9.21 (1 H, s), 10.32 (1 H, brs) .

【0804】

nmr 83) (Working Example 56)

¹H-nmr (200 MHz , DMSO -d₆);de ppm :1.05-2.06 (10 H, m), 2.43 - 3.80 (15 H, m), 4.17 - 4.40 (1 H, m), 4.73 (2 H, m), 6.63 - 7.48 (10 H, m), 7.84 - 7.98 (1 H, m), 8.56 - 8.71 (1 H, m), 9.22 (1 H, s), 10.34 (1 H, brs) .

【0805】

NMR 84)(実施例 57)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.08-2.02(10H,m), 2.62-3.99(18H,m), 4.12-4.39(1H,m), 4.82(2H,s), 6.61-7.57(9H,m), 7.96-8.11(1H,m), 9.33(1H,s), 10.21(1H,brs).

【0806】

NMR 85)(実施例 58)

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ ppm:1.04-2.01(10H,m), 2.43-3.80(15H,m), 4.13-4.40(1H,m), 4.82(2H,s), 6.60-7.53(9H,m), 7.92-8.08(1H,m), 8.56-8.71(1H,m), 9.33(1H,s), 10.35(1H,brs).

【0807】

実施例 139

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{N-[2-(2-メチルフェノキシ)エチル]-N-トリフルオロアセチルアミノ}ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.45gのメタノール20ml溶液に、炭酸カリウム0.11gの水溶液5mlを加え室温にて12時間攪拌した。

メタノールを大半留去し、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。

溶媒を乾燥後、減圧留去した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=80:1→50:1→30:1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにて再結晶して、0.12gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{N-[2-(2-メチルフェノキシ)エチルアミノ}ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0808】

白色粉末状、mp:160-161 deg C。

【0809】

実施例 140

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-トリフルオロアセチルアミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.4gの乾燥テトラヒドロフラン20ml溶液へ、トリフェニルホスフィン0.54g、o-(2-ヒドロキシエトキシ)トルエン0.29gを室温にて加え、次にジエチルアゾジカルボキシレート0.32mlの乾燥テトラヒドロフラン5ml溶液を滴下し、室温にて16時間攪拌した。

【0805】

nmr 84) (Working Example 57)

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆) δ ppm:1.08-2.02 (10 H, m), 2.62 - 3.99 (18 H, m), 4.12 - 4.39 (1 H, m), 4.82 (2 H, s), 6.61 - 7.57 (9 H, m), 7.96 - 8.11 (1 H, m), 9.33 (1 H, s), 10.21 (1 H, brs).

【0806】

nmr 85) (Working Example 58)

¹H-nmr (200 MHz, DMSO-d₆) δ ppm:1.04-2.01 (10 H, m), 2.43 - 3.80 (15 H, m), 4.13 - 4.40 (1 H, m), 4.82 (2 H, s), 6.60 - 7.53 (9 H, m), 7.92 - 8.08 (1 H, m), 8.56 - 8.71 (1 H, m), 9.33 (1 H, s), 10.35 (1 H, brs).

【0807】

Working Example 139

7-chloro-5- { (4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl } -1- { 2-methoxy-4- {N- {2-(2-methyl phenoxy) ethyl } -N- trifluoroacetyl amino } benzoyl } -2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.45g to methanol 20ml solution, 12 hours itagitated with room temperature including aqueous solution 5ml of potassium carbonate 0.1 lg.

majority it removed methanol, it extracted with ethylacetate including water.

After after drying, vacuum distillation doing solvent, residue it attached on silica gel column chromatography (eluate; dichloromethane: methanol = 80:1*50:1*30:1), recrystallization did with acetone-n-hexane, 0.12 g 7-chloro-5- { (4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl } -1- { 2-methoxy-4- {2-(2-methyl phenoxy) ethylamino } benzoyl } -acquired 2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine.

【0808】

white powder, mp:160-161 deg C.

【0809】

Working Example 140

7-chloro-5- { (4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl } -1- { 2-methoxy-4- trifluoroacetyl amino benzoyl } -2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.4g it added triphenyl phosphine 0.54g, o-(2-hydroxyethoxy) toluene 0.29g to dry tetrahydrofuran 20ml solution, with room temperature, next dripped dry tetrahydrofuran 5ml solution of the diethyl azo dicarboxylate 0.32ml, 16 hours agitated with room temperature.

水を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。

エーテル層を乾燥後、溶媒留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=50:1→30:1)に付し、0.46g の 7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{N-[2-(2-メチルフェノキシ)エチル]-N-トリフルオロアセチルアミノ}ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0810】

無色不定形

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.05~5.10(25 H,m), 6.05-7.50(15H,m)。

【0811】

適当な出発原料を用い、実施例 140 と同様にして前記実施例 13~16、74~78、108 及び 110 の化合物を得た。

【0812】

実施例 141

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 2.0g のピリジン 30ml 溶液へ、氷冷下、無水トリフルオロ酢酸 1.14ml を滴下した。

反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。

水洗乾燥後、留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=50:1→30:1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにより結晶化し、1.86g の 7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-トリフルオロアセチルアミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0813】

白色粉末状

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.03~5.08(20 H,m), 2.34(3H,s), 6.58~7.53(6H,m), 8.39~9.04(1H,m)。

【0814】

適当な出発原料を用い、実施例 141 と同様にして前記実施例 7、8 及び 55~58 の化合物を得た。

【0815】

実施例 142

Including water, it extracted with diethyl ether .

After drying, solvent removal it did ether layer , attached on silica gel column chromatography (eluate ;dichloromethane :methanol =50:1*30:1),0.46 g 7 -chloro -5- { (4 -methyl -1- piperazinyl) carbonyl methyl } - 1 - { 2 -methoxy -4- {N- { 2 - (2 -methyl phenoxy) ethyl } -N- trifluoroacetyl amino } benzoyl } - acquired 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine .

【0810】

colorless amorphous

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.05~5.10 (25 H, m) , 6.05 - 7.50 (15 H, m) .

【0811】

Aforementioned Working Example 13~16, 74~78, 108 and compound of 110 were acquired making use of suitable starting material , to similar to Working Example 140.

【0812】

Working Example 141

7 -chloro -5- { (4 -methyl -1- piperazinyl) carbonyl methyl } - 1 - (2 -methoxy -4- amino benzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 2.0g under ice cooling , trifluoroacetic anhydride 1.14ml was dripped to pyridine 30ml solution .

In reaction mixture it extracted with ethylacetate including saturated aqueous sodium bicarbonate solution .

After water wash drying, it removed, residue attached on silica gel column chromatography (eluate ;dichloromethane :methanol =50:1*30:1),crystallization it did with acetone -n- hexane , 1.86 g 7 -chloro -5- { (4 -methyl -1- piperazinyl) carbonyl methyl } - 1 - (2 -methoxy -4- trifluoroacetyl amino benzoyl) -acquired 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine .

【0813】

white powder

¹H-NMR (200 MHz , CDCl₃);de ppm :1.03~5.08 (20 H, m) , 2.34 (3 H, s) , 6.58 - 7.53 (6 H, m) , 8.39 - 9.04 (1 H, m) .

【0814】

Aforementioned Working Example 7, 8 and compound 55 - 58 was acquired making use of suitable starting material , to similar to Working Example 141.

【0815】

Working Example 142

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.8g のメタノール 30ml 溶液へ、o-トルアルデヒド 0.35ml 及び酢酸 1ml を加え、50-60 deg C で 2-3 時間攪拌後、水素化シアノホウ素ナトリウム 0.11g を室温にて加え、2 時間攪拌した。

メタノールを減圧留去し、水を加えて酢酸エチルにて抽出した。

酢酸エチル層を乾燥後留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=50:1→25:1)に付し、アセトン-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.71g の 7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-(2-メチルベンジルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0816】

白色粉末状、mp:153-154.5 deg C。

【0817】

適当な出発原料を用い、実施例 142 と同様にして前記実施例 13-16、75-78、108、110 及び 137 の化合物を得た。

【0818】

実施例 143

7-クロロ-5-メトキシカルボニルメチル-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 2.6g のエタノール 100ml 懸濁液に炭酸ナトリウム 1.5g、o-キシレンジブロマイド 1.87g 及び沃化ナトリウム 2.42g を加え、60-70 deg C にて、3 時間攪拌した。

エタノールを減圧留去し、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。

酢酸エチル層を乾燥後、減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10→1:5)に付し、0.32g の 7-クロロ-5-メトキシカルボニルメチル-1-[2-メトキシ-4-(2-イソインドリニル)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0819】

無色不定形

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-2.21(5H, m), 2.51-3.26(3H,m), 3.27-4.11(4H,m), 3.77(3 H,s), 4.36-4.88(4H,m), 5.71-7.58(10H,m)。

7-chloro-5- { (4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl } -1-(2-methoxy-4-amino benzoyl)-2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.8g to methanol 30ml solution, including o-tolualdehyde 0.35ml and acetic acid 1ml, with 50-60 deg C it added 2-3 hours after stirring, sodium cyanoborohydride 0.11g with room temperature, 2 hours agitated.

vacuum distillation it did methanol, it extracted with ethylacetate including thewater.

After drying it removed ethyl acetate layer, residue it attached on silica gel column chromatography (eluate; dichloromethane:methanol=50:1*25:1), recrystallization did with acetone-diethyl ether, 0.71 g 7-chloro-5- { (4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl } -1-(2-methoxy-4-(2-methylbenzyl amino) benzoyl } -acquired 2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine.

【0816】

white powder, mp:153-154.5deg C.

【0817】

Aforementioned Working Example 13-16, 75-78, 108, 110 and compound of 137 were acquired making use of suitable starting material, to similar to Working Example 142.

【0818】

Working Example 143

7-chloro-5-methoxycarbonyl methyl-1-(2-methoxy-4-amino benzoyl)-2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 2.6g with 60-70 deg C, 3 hours itagitated to ethanol 100ml suspension including sodium carbonate 1.5g, o-xylene dibromide 1.87g and sodium iodide 2.42g.

vacuum distillation it did ethanol, it extracted with ethylacetate including thewater.

After drying, vacuum distillation it did ethyl acetate layer, residue attached on the silica gel column chromatography (eluate;ethylacetate:n-hexane=1:10*1:5), 0.32 g 7-chloro-5-methoxycarbonyl methyl-1-(2-methoxy-4-(2-isoindoliny) benzoyl } -acquired 2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine.

【0819】

colorless amorphous

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm:1.10-2.21 (5 H, m), 2.51-3.26 (3 H, m), 3.27-4.11 (4 H, m), 3.77 (3 H, s), 4.36-4.88 (4 H, m), 5.71-7.58 (10 H, m).

【0821】

実施例 144

7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-ヒドロキシベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.7g の乾燥ジメチルホルムアミド 20ml 溶液へ、炭酸カリウム 0.35g 及び 2-クロロベンジルクロリド 0.32ml を加え、室温にて一晩攪拌した。

反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。

水洗乾燥後、溶媒留去し、アセトン-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.76g の 7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-(2-クロロベンジロキシ)ベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0822】

白色粉末状、mp:135 deg C。

【0823】

適当な出発原料を用い、実施例 144 と同様にし、前記実施例 24-33、41、43-45、47、49-51、86-88 及び 98 の化合物を得た。

【0824】

実施例 145

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-ホルミルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.29g のメタノール 30ml 溶液に、o-トルイジン 0.2ml 及び酢酸を pH4 になるまで加え、50 deg C で 8 時間加熱攪拌後、氷冷下、水素化シアノホウ素ナトリウム 0.085g を加え、1 時間攪拌した。

メタノールを減圧留去後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。

水洗乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルラムクロマトグラフィー(溶出液:ジクロロメタン:メタノール=100:1→50:1)に付し、0.1g の 7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-(2-メチルアニリノメチル)ベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0825】

無色不定形

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.10-5.24(26H, m), 6.32-7.69(11H,m)。

【0826】

適当な出発原料を用い、実施例 145 と同様にし、前記実施例 36 の化合物を得た。

【0821】

Working Example 144

7-chloro-1-(3-methoxy-4-hydroxy benzoyl)-2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.7g to dry dimethylformamide 20ml solution, including potassium carbonate 0.35g and 2-chloro benzyl chloride 0.32ml, overnight it agitated with room temperature.

In reaction mixture it extracted with ethylacetate including water.

After water wash drying, solvent removal it did, recrystallization did with acetone-diethyl ether, 0.76 g 7-chloro-1-(3-methoxy-4-(2-chloro benzyloxy) benzoyl)-2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine.

【0822】

white powder, mp:135deg C.

【0823】

Aforementioned Working Example 2 4~33, 41, 43~45, 47, 49~51, 86~88 and compound of 98 were acquired making use of suitable starting material, to similar to Working Example 144.

【0824】

Working Example 145

7-chloro-5-{(4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl}-1-(4-formyl benzoyl)-2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.29g until it becomes the pH 4, it added o-toluidine 0.2ml and acetic acid to methanol 30ml solution, 1 hour it agitated with 50 deg C 8-hour heating and stirring after, including under ice cooling, sodium cyanoborohydride 0.085g.

methanol was extracted with ethylacetate after vacuum distillation, including the water.

After water wash drying, solvent removal it did, residue attached on silica gel column chromatography (eluate; dichloromethane: methanol=100:1*50:1), 0.1 g 7-chloro-5-{(4-methyl-1-piperazinyl) carbonyl methyl}-1-(4-(2-methyl anilino methyl) benzoyl)-2,3,4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine.

【0825】

colorless amorphous

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm:1.10-5.24 (26 H, m), 6.32-7.69 (11 H, m).

【0826】

compound of aforementioned Working Example 36 was acquired making use of the suitable starting material, to

て前記実施例 36 の化合物を得た。

【0827】

実施例 146

7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.7g のピリジン 5ml 溶液に、N,N-ジメチルカルバミン酸クロリド 0.42ml を加え、60~70 deg C にて、2 時間攪拌した。

塩酸酸性とし、酢酸エチルにて抽出した。

飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10→1:1→3:1)に付し、エタノール-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.33g の 7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-ジメチルアミノカルボニルアミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0828】

mp:230~232 deg C、白色板状。

【0829】

適当な出発原料を用い、実施例 1 及び 2 と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【0830】

【表 125】

similar to Working Example 145.

[0827]

Working Example 146

7-chloro -1- (3 -methoxy -4- amino benzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.7g to pyridine 5ml solution , with 60 - 70 deg C, 2 hours it agitated including N, N-dimethyl carbamic acid chloride 0.42ml .

It made hydrochloric acid acidity , extracted with ethylacetate .

After washing, solvent removal it did with saturated aqueous sodium bicarbonate solution , residue it attached on silica gel column chromatography (eluate ;ethylacetate :n- hexane =1:10*1:1*3:1) , recrystallization did with ethanol -diethyl ether , 0.33 g 7 -chloro -1- (3 -methoxy -4- dimethylamino carbonyl amino benzoyl)- acquired 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine .

[0828]

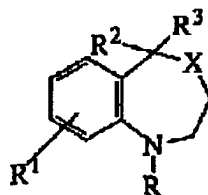
mp:230~232deg C, white platelet .

[0829]

compound which is stated in below-mentioned chart making use of suitable starting material , to similar to Working Example 1 and 2 was acquired.

[0830]

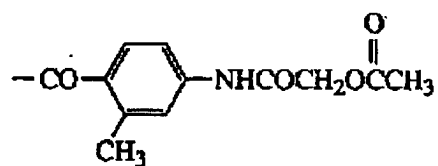
[Table 125]



実施例 147

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【0831】

【表 126】

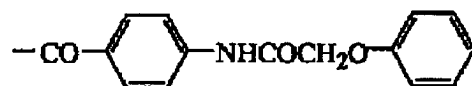
[0831]

[Table 126]

実施例 148

構造

R :

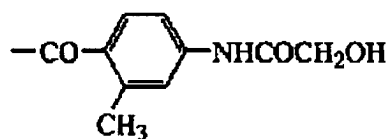
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 149

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 194 - 195℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0832】

[0832]

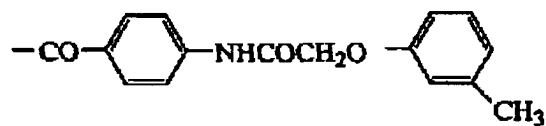
【表 127】

[Table 127]

実施例 150

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

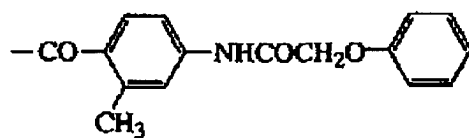
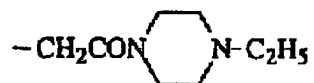
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 151

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0833】

[0833]

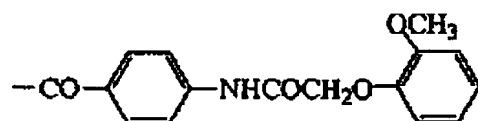
【表 128】

[Table 128]

実施例 152

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 153

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0834】

[0834]

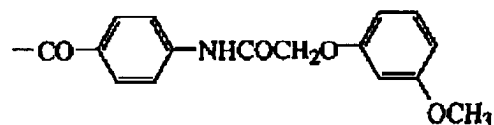
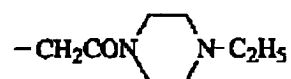
【表 129】

[Table 129]

実施例 154

構造

R :

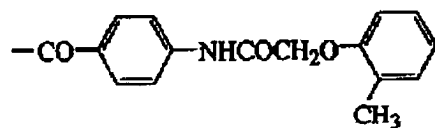
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 155

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0835】

[0835]

【表 130】

[Table 130]

実施例 156

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

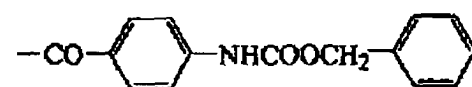
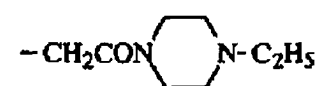
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 157

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0836】

[0836]

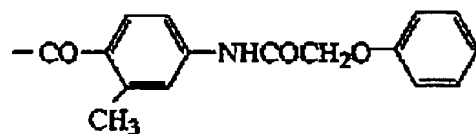
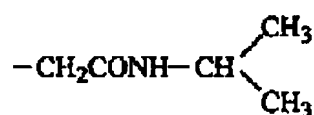
【表 131】

[Table 131]

実施例 158

構造

R :

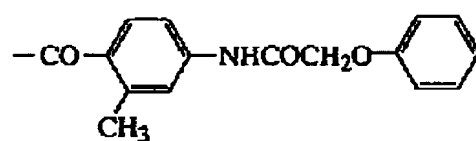
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 159

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0837】

[0837]

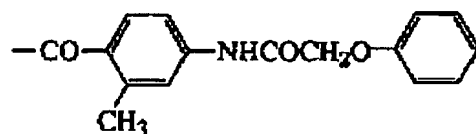
【表 132】

[Table 132]

実施例 160

構造

R :

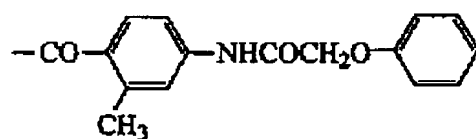
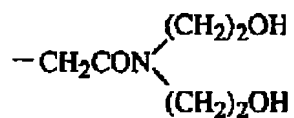
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 161

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0838】

[0838]

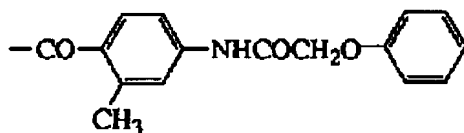
【表 133】

[Table 133]

実施例 162

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

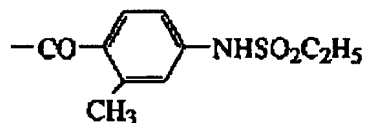
結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

実施例 163

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0839】

[0839]

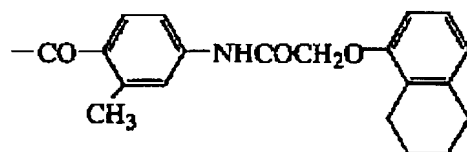
【表 134】

[Table 134]

実施例 164

構造

R :

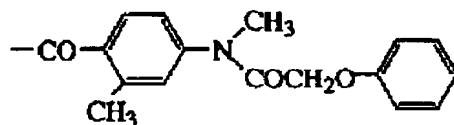
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 融点 : 230 - 232℃ (分解)
 形態 : 遊離

実施例 165

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 黄色不定形
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0840】

[0840]

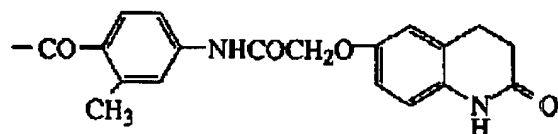
【表 135】

[Table 135]

実施例 166

構造

R :

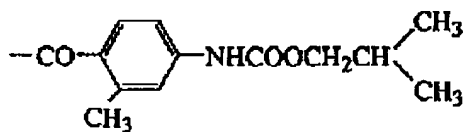
X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : H R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状
 融点 : 243 - 245℃ (分解)
 形態 : 遊離

実施例 167

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : H R^3 : H

結晶形 : 無色不定形
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0841】

[0841]

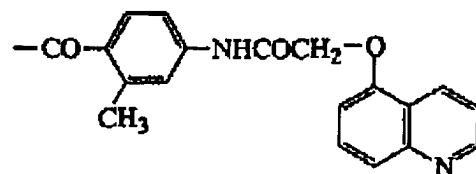
【表 136】

[Table 136]

実施例 168

構造

R :

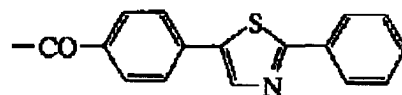
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
融点 : 203 - 205℃ (分解)
形態 : 遊離

実施例 169

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 褐色粉末状
融点 : 178 - 180℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0842】

[0842]

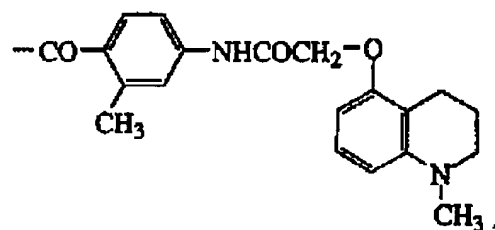
【表 137】

[Table 137]

実施例 170

構造

R :

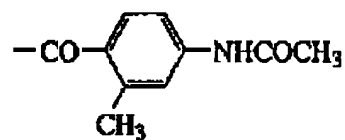
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 融点 : 202 - 204℃ (分解)
 形態 : 遊離

実施例 171

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 融点 : 118 - 120℃
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0843】

[0843]

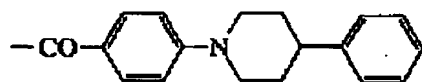
【表 138】

[Table 138]

実施例 172

構造

R :

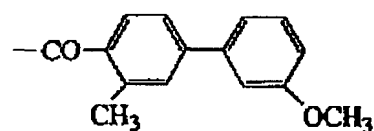
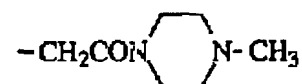
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 179 - 181℃ (分解)
形態 : 遊離

実施例 173

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0844】

[0844]

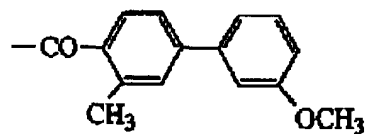
【表 139】

[Table 139]

実施例 174

構造

R :

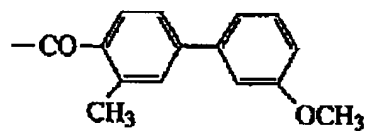
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 175

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0845】

[0845]

【表 140】

[Table 140]

実施例 176

構造

R :

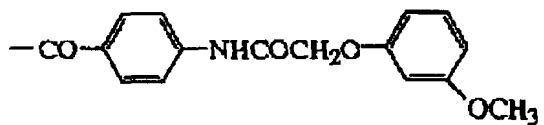
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 177

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0846】

[0846]

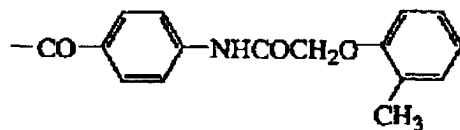
【表 141】

[Table 141]

実施例 178

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 179

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0847】

[0847]

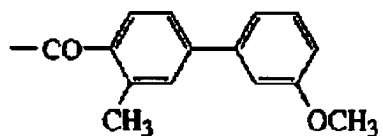
【表 142】

[Table 142]

実施例 180

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

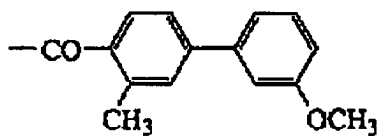
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 181

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0848】

[0848]

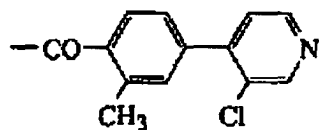
【表 143】

[Table 143]

実施例 182

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

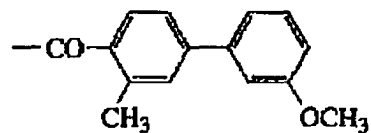
結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

実施例 183

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0849】

[0849]

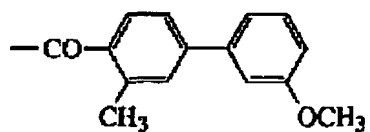
【表 144】

[Table 144]

実施例 184

構造

R :

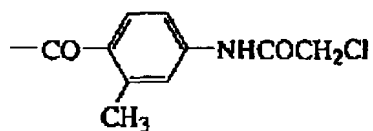
X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 185

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0850】

[0850]

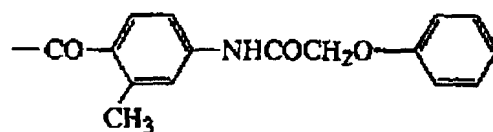
【表 145】

[Table 145]

実施例 186

構造

R :

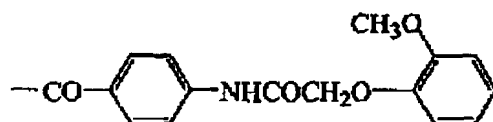
X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{---CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 187

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{---CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0851】

{0851}

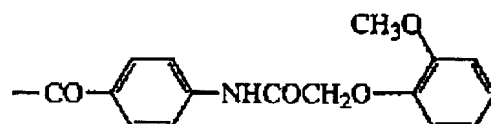
【表 146】

[Table 146]

実施例 188

構造

R :

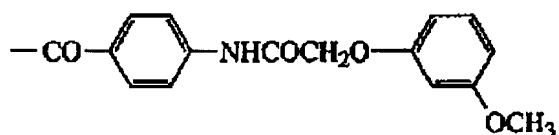
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 189

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0852】

[0852]

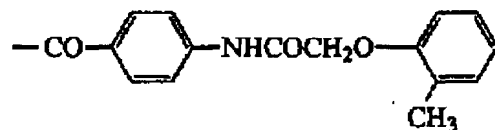
【表 147】

[Table 147]

実施例 190

構造

R :

X : $\text{—CH}_2\text{—}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{—CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

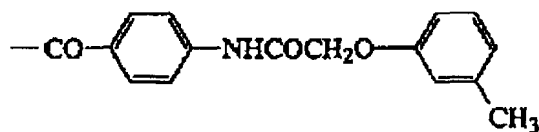
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 191

構造

R :

X : $\text{—CH}_2\text{—}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{—CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 130 - 132℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0853】

[0853]

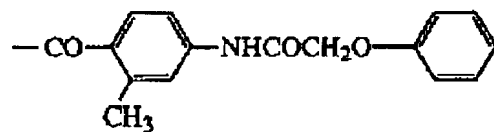
【表 148】

[Table 148]

実施例 192

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{---CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 193

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{---CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0854】

[0854]

【表 149】

[Table 149]

実施例 194

構造

R :

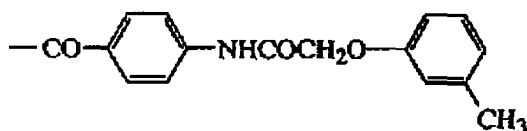
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 195

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0855】

[0855]

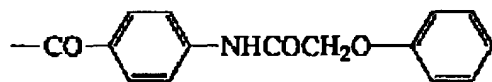
【表 150】

[Table 150]

実施例 196

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{---CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

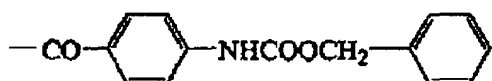
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 197

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{---CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0856】

[0856]

【表 151】

[Table 151]

実施例 198

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

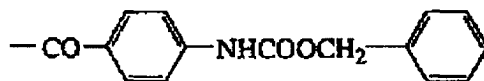
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 199

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0857】

[0857]

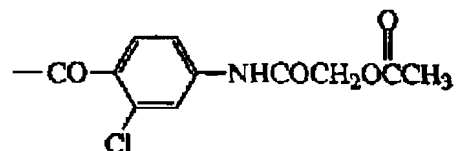
【表 152】

[Table 152]

実施例 200

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

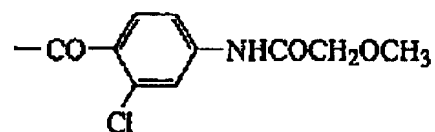
融点 (°C) : 188 - 190

形態 : 遊離

実施例 201

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0858】

[0858]

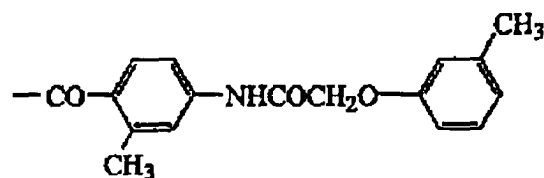
【表 153】

[Table 153]

実施例 202

構造

R :

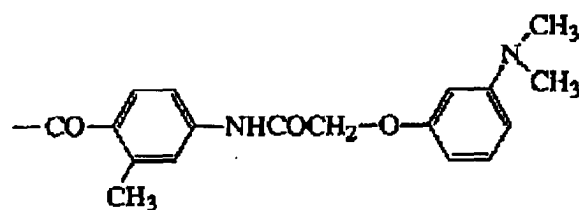
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 203

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0859】

[0859]

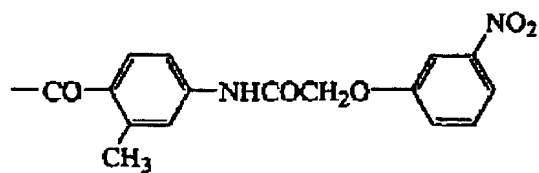
【表 154】

[Table 154]

実施例 204

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

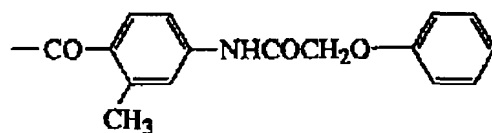
融点 : 186.5 - 188℃

形態 : 遊離

実施例 205

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0860】

[0860]

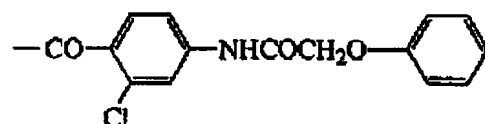
【表 155】

[Table 155]

実施例 206

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

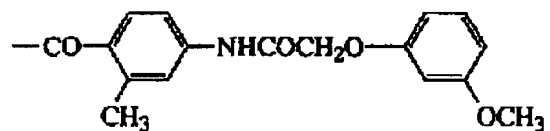
結晶形 : 黄色不定形

形態 : HCl

実施例 207

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0861】

[0861]

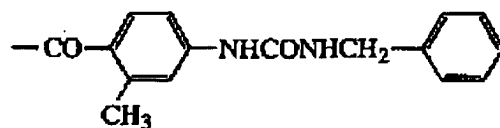
【表 156】

[Table 156]

実施例 208

構造

R :

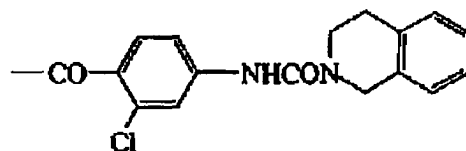
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 209

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0862】

[0862]

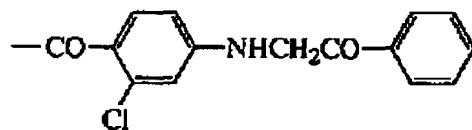
【表 157】

[Table 157]

実施例 210

構造

R :

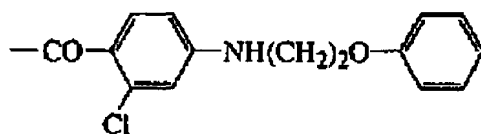
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 211

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0863】

[0863]

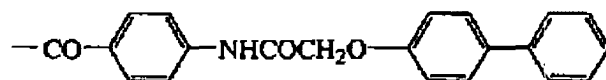
【表 158】

[Table 158]

実施例 212

構造

R :

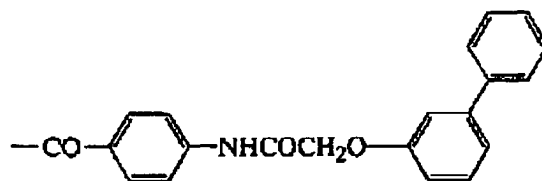
X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : H R^3 : H

結晶形 : 無色針状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル
融点 : 204 - 205℃
形態 : 遊離

実施例 213

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : H R^3 : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル
融点 : 157.5 - 159℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0864】

[0864]

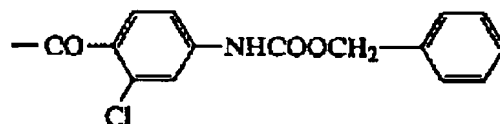
【表 159】

[Table 159]

実施例 214

構造

R :

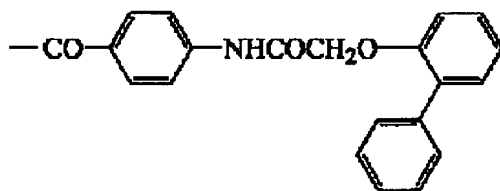
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 215

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル
融点 : 168 - 169.5℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0865】

[0865]

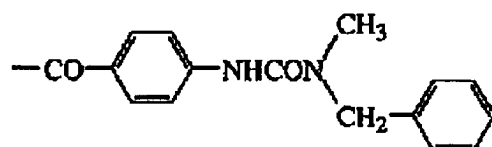
【表 160】

[Table 160]

実施例 216

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

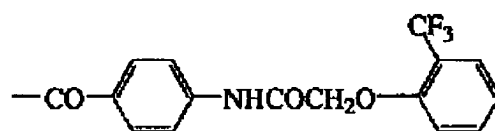
融点 : 177 - 178℃

形態 : 遊離

実施例 217

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル洗淨

融点 : 195.5 - 197℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0866】

[0866]

【表 161】

[Table 161]

実施例 218

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 177 - 178℃

形態 : 遊離

実施例 219

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル - n - ヘキサン 洗浄

融点 : 234 - 234.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0867】

[0867]

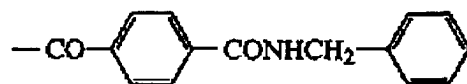
【表 162】

[Table 162]

実施例 220

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 221

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗淨
融点 : 143 - 144.5℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0868】

[0868]

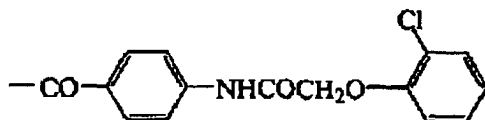
【表 163】

[Table 163]

実施例 222

構造

R :

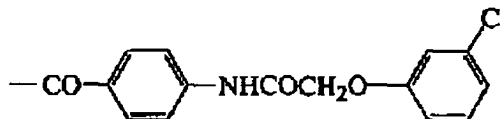
X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 微橙色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル洗浄
融点 : 231.5 - 233℃
形態 : 遊離

実施例 223

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 164 - 165℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0869】

[0869]

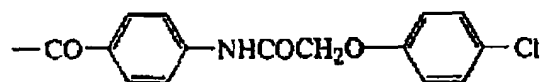
【表 164】

[Table 164]

実施例 224

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 微橙色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

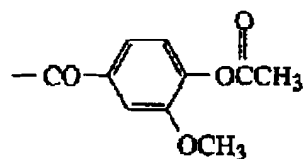
融点 : 175 - 176.5℃

形態 : 遊離

実施例 225

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 127.5 - 128.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0870】

[0870]

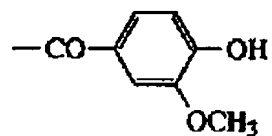
【表 165】

[Table 165]

実施例 226

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

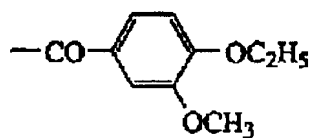
融点 : 176 - 177℃

形態 : 遊離

実施例 227

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 104.5 - 105.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0871】

[0871]

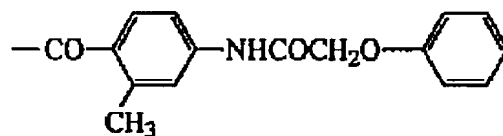
【表 166】

[Table 166]

実施例 228

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

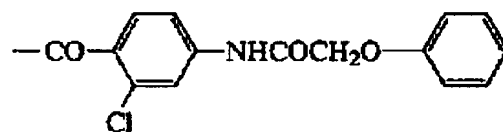
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 229

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0872】

[0872]

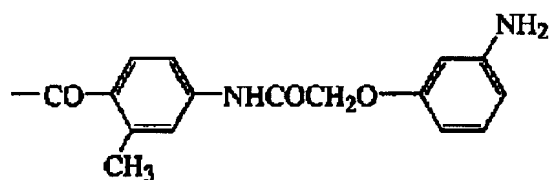
【表 167】

[Table 167]

実施例 230

構造

R :

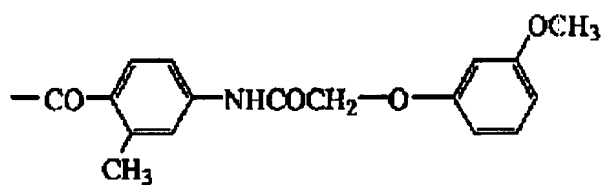
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

実施例 231

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0873】

[0873]

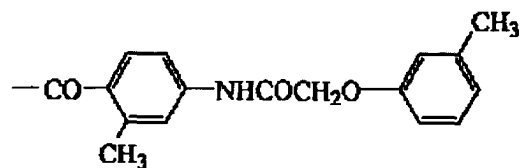
【表 168】

[Table 168]

実施例 232

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

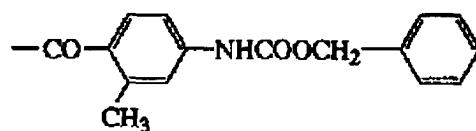
結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 233

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0874】

[0874]

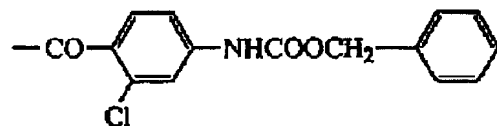
【表 169】

[Table 169]

実施例 234

構造

R :

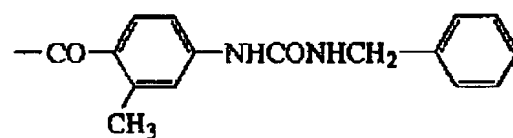
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 235

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0875】

[0875]

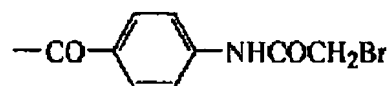
【表 170】

[Table 170]

実施例 236

構造

R :

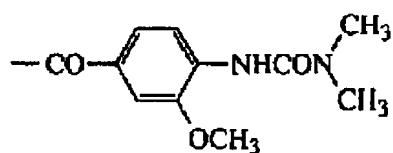
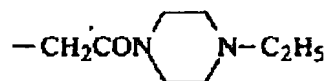
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 茶色粉末状
 再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄
 融点 : 156 - 159℃
 形態 : 遊離

実施例 237

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0876】

[0876]

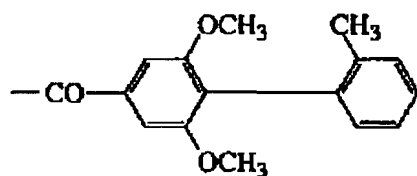
【表 171】

[Table 171]

実施例 238

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

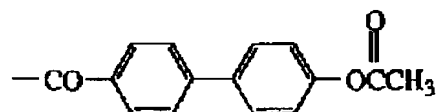
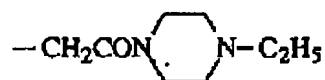
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 239

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0877】

[0877]

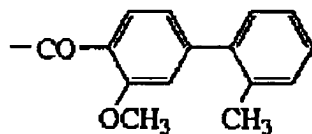
【表 172】

[Table 172]

実施例 240

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

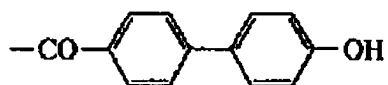
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 241

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0878】

[0878]

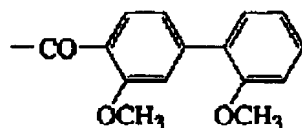
【表 173】

[Table 173]

実施例 242

構造

R :

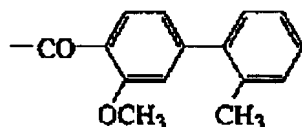
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 243

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0879】

[0879]

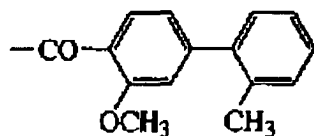
【表 174】

[Table 174]

実施例 244

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{OCH}_2\text{COOH}$ R³ : H

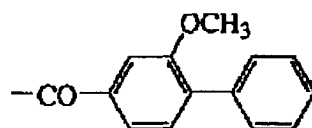
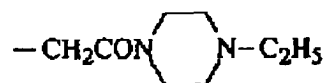
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 245

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0880】

[0880]

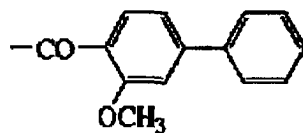
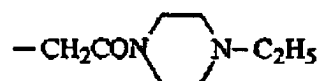
【表 175】

[Table 175]

実施例 246

構造

R :

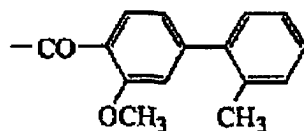
X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 247

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0881】

[0881]

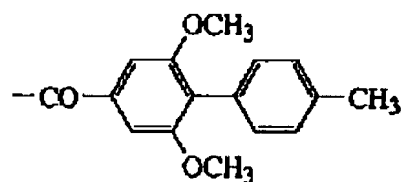
【表 176】

[Table 176]

実施例 248

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

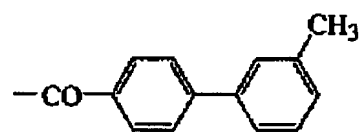
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 249

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒: アセトン-n-ヘキサン

融点 : 84 - 85.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0882】

[0882]

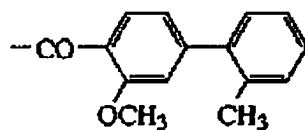
【表 177】

[Table 177]

実施例 250

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

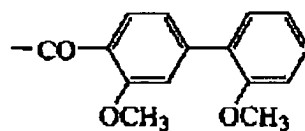
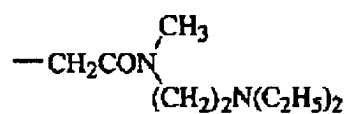
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 251

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0883】

[0883]

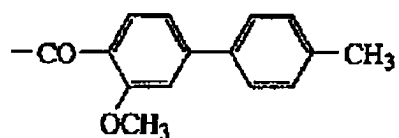
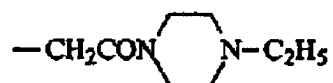
【表 178】

[Table 178]

実施例 252

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

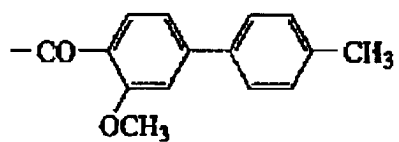
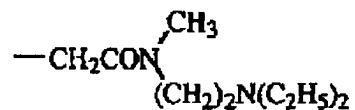
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 253

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0884】

[0884]

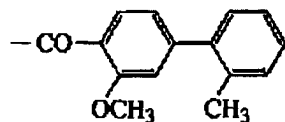
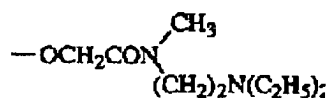
【表 179】

[Table 179]

実施例 254

構造

R :

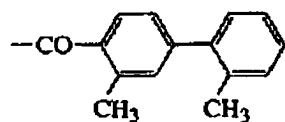
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 255

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0885】

[0885]

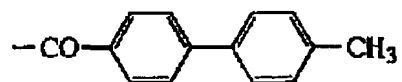
【表 180】

[Table 180]

実施例 256

構造

R :

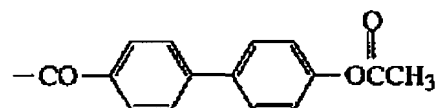
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 181.5 - 182℃
形態 : 遊離

実施例 257

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 181 - 182℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0886】

[0886]

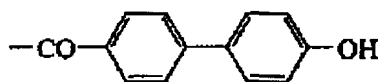
【表 181】

[Table 181]

実施例 258

構造

R :

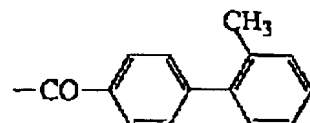
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 262 - 265℃
形態 : 遊離

実施例 259

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 159 - 160℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0887】

[0887]

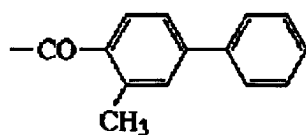
【表 182】

[Table 182]

実施例 260

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$ R³ : H

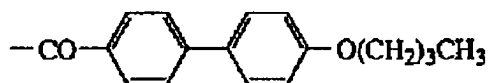
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 261

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン

融点 : 153℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0888】

[0888]

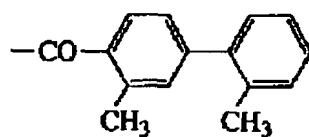
【表 183】

[Table 183]

実施例 262

構造

R :

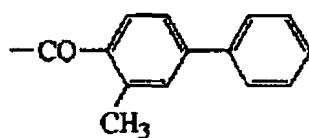
X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 263

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0889】

[0889]

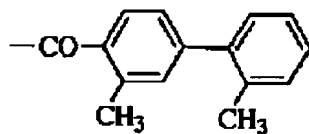
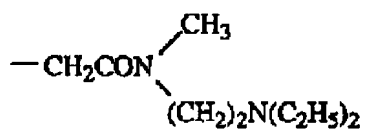
【表 184】

[Table 184]

実施例 264

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

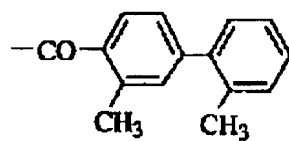
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 265

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONHCH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0890】

[0890]

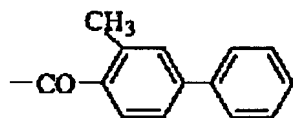
【表 185】

[Table 185]

実施例 266

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$ R³ : H

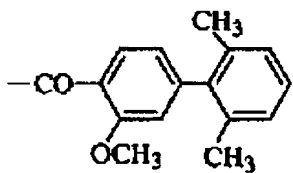
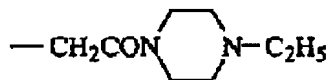
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 267

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0891】

[0891]

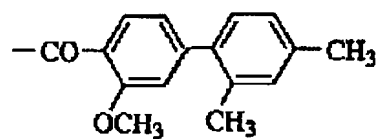
【表 186】

[Table 186]

実施例 268

構造

R :

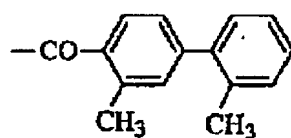
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 269

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0892】

[0892]

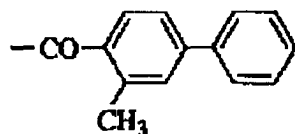
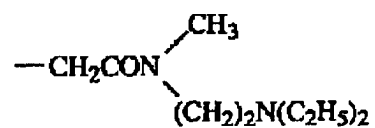
【表 187】

[Table 187]

実施例 270

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

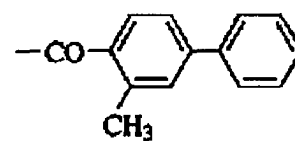
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 271

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0893】

[0893]

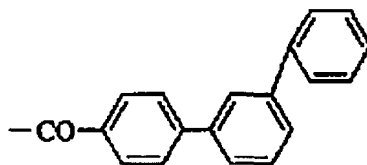
【表 188】

[Table 188]

実施例 272

構造

R :

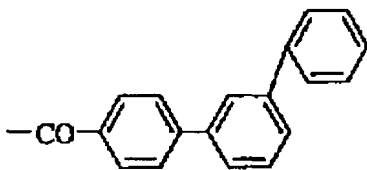
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 273

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0894】

[0894]

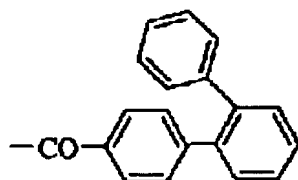
【表 189】

[Table 189]

実施例 274

構造

R :

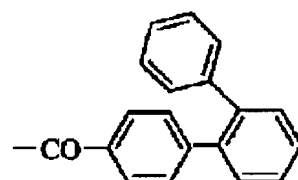
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 275

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0895】

[0895]

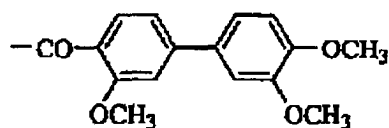
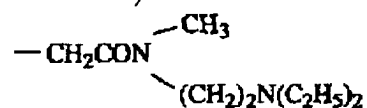
【表 190】

[Table 190]

実施例 276

構造

R :

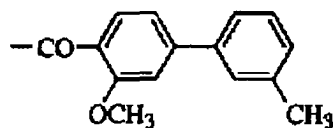
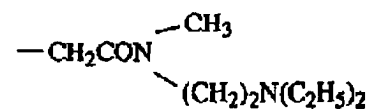
X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 277

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0896】

[0896]

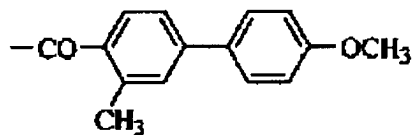
【表 191】

[Table 191]

実施例 278

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

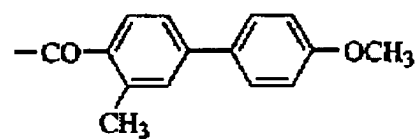
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 279

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0897】

[0897]

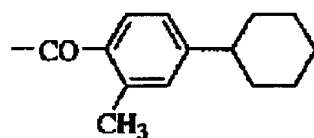
【表 192】

[Table 192]

実施例 280

構造

R :

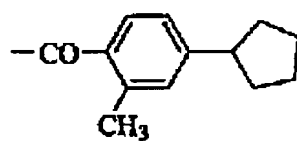
X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 :$  $\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : エタノール-n-ヘキサン
 融点 : 218 - 221℃
 形態 : HCl

実施例 281

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 :$  $\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
 融点 : 214 - 217℃
 形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0898】

[0898]

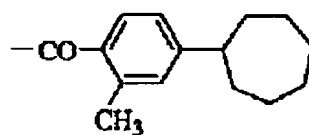
【表 193】

[Table 193]

実施例 282

構造

R :

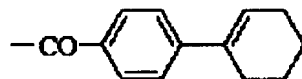
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
 融点 : 204 - 206℃
 形態 : HCl

実施例 283

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONHCH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0899】

[0899]

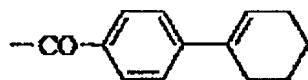
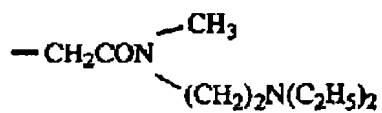
【表 194】

[TRANSLATION STALLEDTable 194]

実施例 284

構造

R :

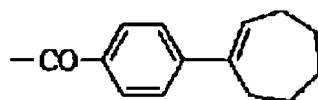
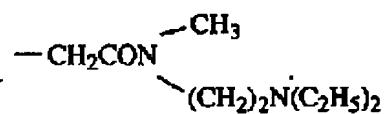
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 285

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0900】

[0900]

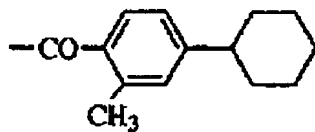
【表 195】

[Table 195]

実施例 286

構造

R :

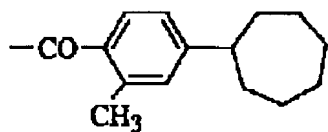
X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 :$  $\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 287

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$ $\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0901】

[0901]

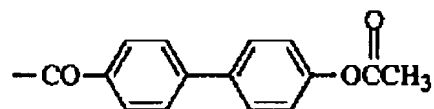
【表 196】

[Table 196]

実施例 288

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

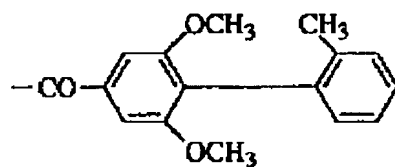
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 289

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0902】

[0902]

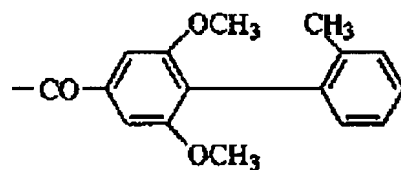
【表 197】

[Table 197]

実施例 290

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

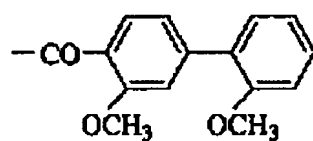
融点 : 240 - 242℃

形態 : 遊離

実施例 291

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0903】

[0903]

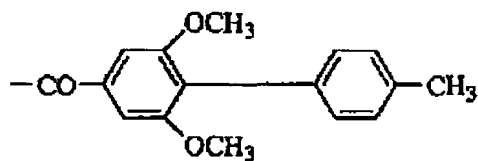
【表 198】

[Table 198]

実施例 292

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

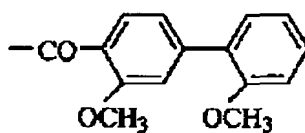
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 293

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0904】

[0904]

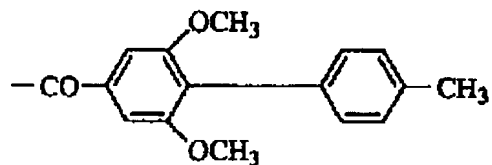
【表 199】

[Table 199]

実施例 294

構造

R :

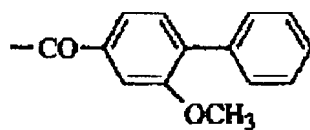
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 295

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0905】

[0905]

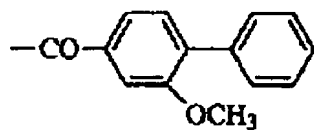
【表 200】

{Table 20 0 }

実施例 296

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R^3 : H

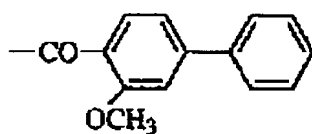
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 297

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl R^2 : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0906】

[0909]

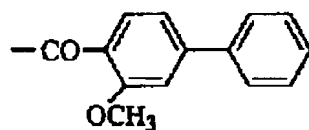
【表 201】

{Table 20 1 }

実施例 298

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

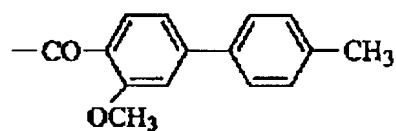
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 299

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0907】

[0907]

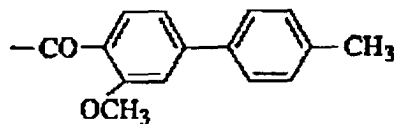
【表 202】

{Table 20 2 }

実施例 300

構造

R :

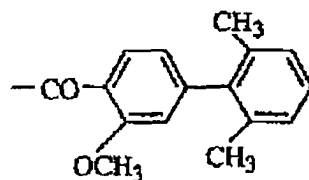
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 301

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0908】

[0908]

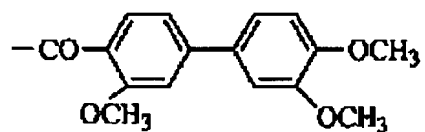
【表 203】

{Table 20 3 }

実施例 302

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

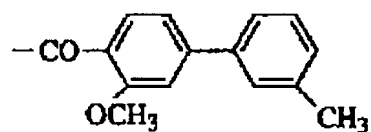
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 303

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0909】

[0909]

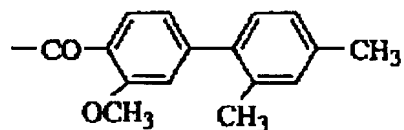
【表 204】

{Table 20 4 }

実施例 304

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

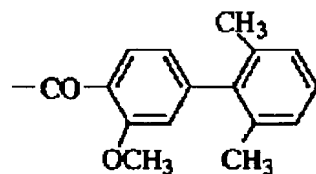
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 305

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 251 - 253℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0910】

[0910]

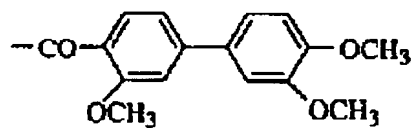
【表 205】

{Table 20 5 }

実施例 306

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

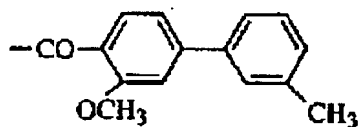
融点 : 128 - 131℃

形態 : 遊離

実施例 307

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0911】

[0911]

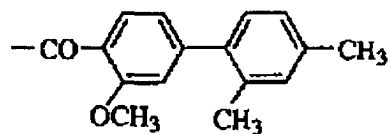
【表 206】

{Table 20 6 }

実施例 308

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : エタノール

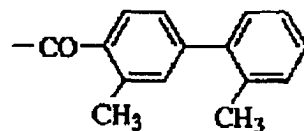
融点 : 224 - 225℃

形態 : 遊離

実施例 309

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0912】

[0912]

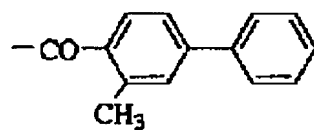
【表 207】

{Table 20 7 }

実施例 310

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

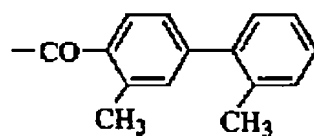
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 311

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0913】

[0913]

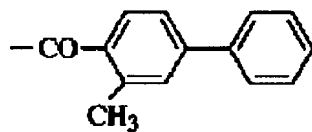
【表 208】

{Table 20 8 }

実施例 312

構造

R :

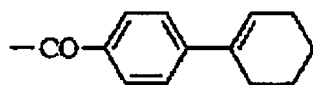
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 313

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0914】

[0914]

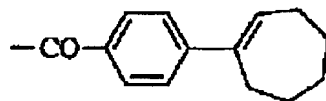
【表 209】

{Table 20 9 }

実施例 314

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

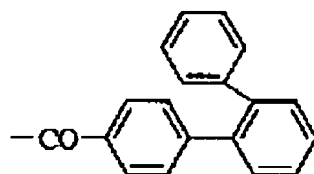
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 315

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0915】

[0915]

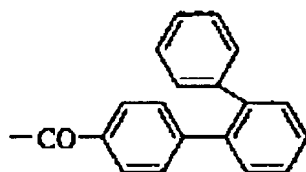
【表 210】

{Table 21 0 }

実施例 316

構造

R :

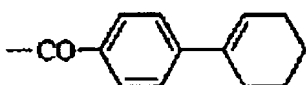
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 124 - 128℃
形態 : 遊離

実施例 317

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0916】

[0916]

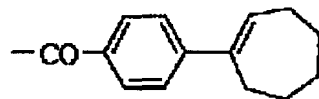
【表 211】

{Table 21 1 }

実施例 318

構造

R :

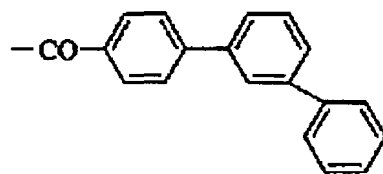
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 319

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0917】

[0917]

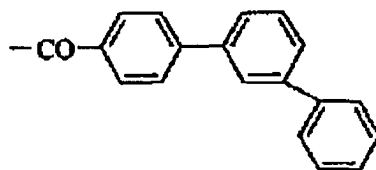
【表 212】

{Table 21 2 }

実施例 320

構造

R :

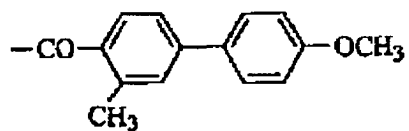
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 321

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0918】

[0918]

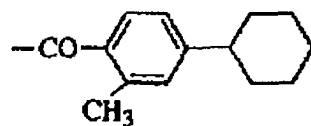
【表 213】

{Table 21 3 }

実施例 322

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

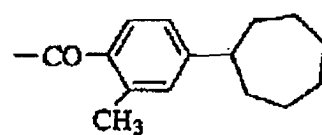
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 323

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0919】

[0919]

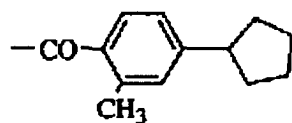
【表 214】

{Table 21 4 }

実施例 324

構造

R :

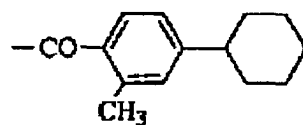
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 325

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0920】

[0920]

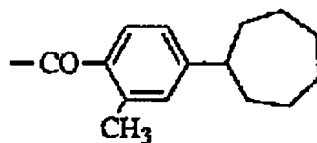
【表 215】

{Table 21 5 }

実施例 326

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂COOHR³ : H

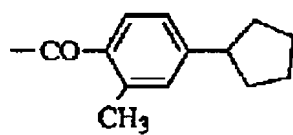
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 327

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0921】

[0921]

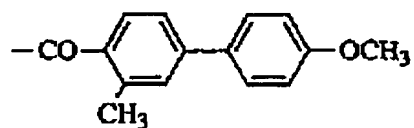
【表 216】

{Table 21 6 }

実施例 328

構造

R :

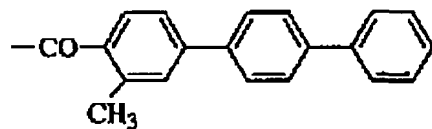
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 329

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0922】

[0922]

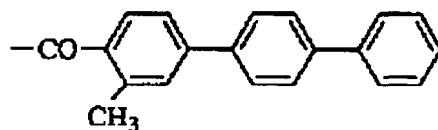
【表 217】

{Table 21 7 }

実施例 330

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

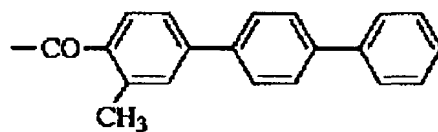
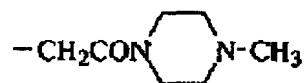
融点 : 203 - 204℃

形態 : 遊離

実施例 331

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 255 - 258℃

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0923】

[0923]

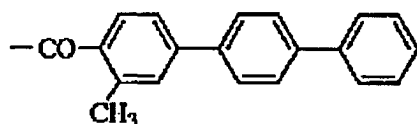
【表 218】

{Table 21 8 }

実施例 332

構造

R :

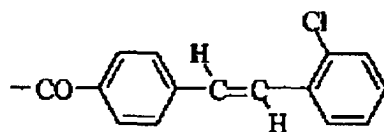
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 333

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0924】

[0924]

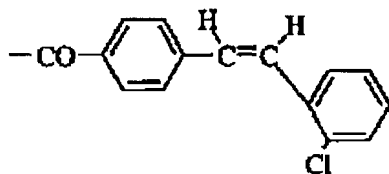
【表 219】

{Table 21 9 }

実施例 334

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

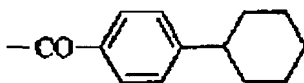
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 335

構造

R :

X : $=\text{CH}-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0925】

[0925]

【表 220】

{Table 2 20 }

実施例 336

構造

R :

X : =CH— R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 337

構造

R :

X : =CH— R¹ : 7-ClR² : $\text{—CH}_2\text{CONH(CH}_2)_2\text{N(C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0926】

[0926]

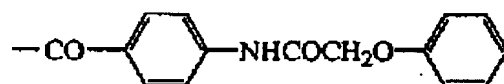
【表 221】

{Table 2 21 }

実施例 338

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : HR² : $\text{---CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

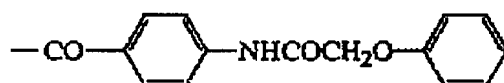
融点 : 102 - 106°C

形態 : 遊離

実施例 339

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0927】

[0927]

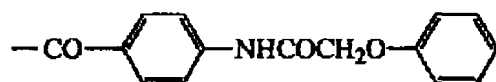
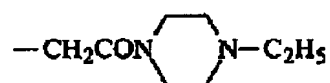
【表 222】

{Table 2 22 }

実施例 340

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

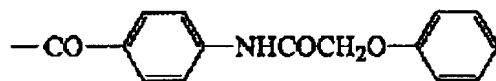
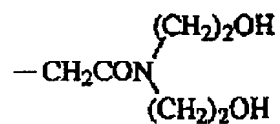
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 341

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0928】

[0928]

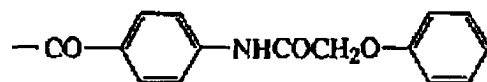
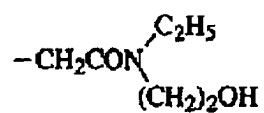
【表 223】

{Table 2 23 }

実施例 342

構造

R :

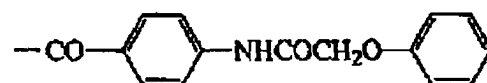
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 343

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色針状
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 190 - 193℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0929】

[0929]

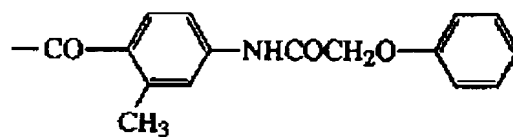
【表 224】

{Table 2 24 }

実施例 344

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

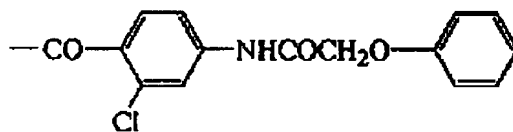
結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

実施例 345

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0930】

[0930]

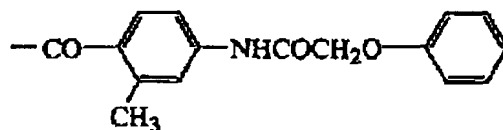
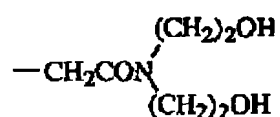
【表 225】

{Table 2 25 }

実施例 346

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

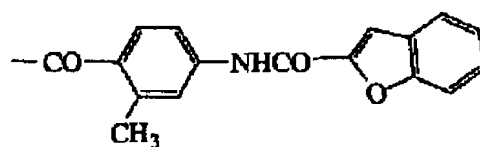
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 347

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 180 - 182℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0931】

[0931]

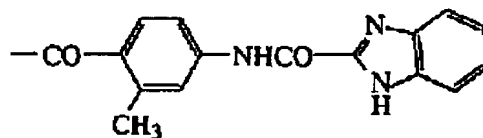
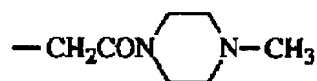
【表 226】

{Table 2 26 }

実施例 348

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジクロロメタン-ジエチルエーテル

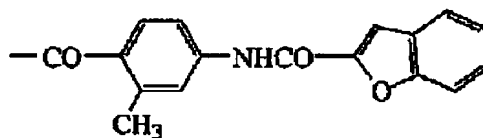
融点 : 239 - 241℃

形態 : 遊離

実施例 349

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$ R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 252 - 254℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0932】

[0932]

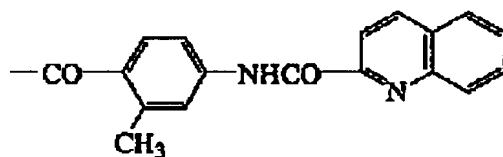
【表 227】

{Table 2 27 }

実施例 350

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油状
形態 : 遊離

実施例 351

構造

R :

X : $=\text{CH}-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
融点 : 71 - 75℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0933】

[0933]

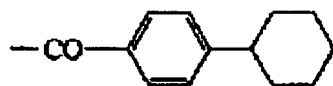
【表 228】

{Table 2 28 }

実施例 352

構造

R :



X : =CH-

R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂C₂H₅R³ : H

結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

実施例 353

構造

R :



X : =CH-

R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0934】

[0934]

【表 229】

{Table 2 29 }

実施例 354

構造

R :



X : =CH-

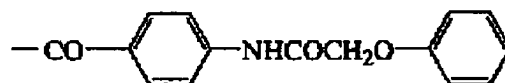
R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

実施例 355

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 63 - 69℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0935】

[0935]

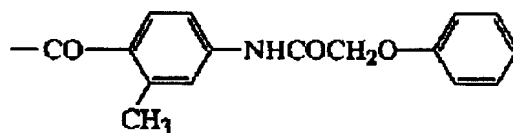
【表 230】

{Table 23 0 }

実施例 356

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

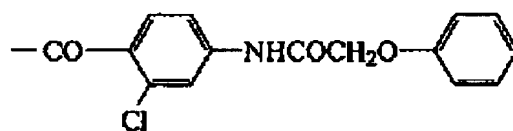
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 357

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0936】

[0936]

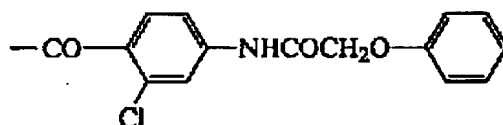
【表 231】

{Table 23 1 }

実施例 358

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

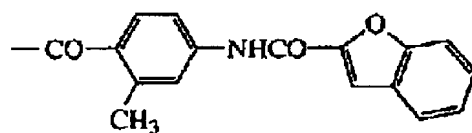
結晶形 : 無色粘稠油状

形態 : 遊離

実施例 359

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0937】

[0937]

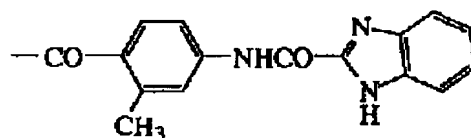
【表 232】

{Table 23 2 }

実施例 360

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

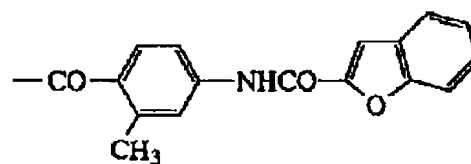
結晶形 : 無色粘稠油状

形態 : 遊離

実施例 361

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0938】

[0938]

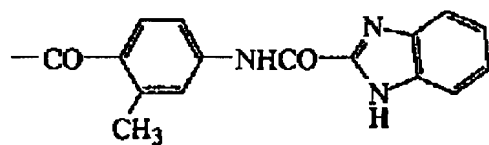
【表 233】

{Table 23 3 }

実施例 362

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

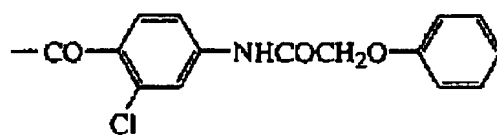
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 363

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² 及び R³ : =O

結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0939】

[0939]

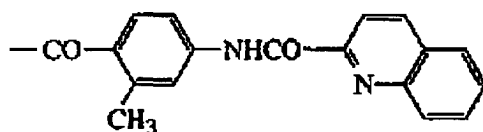
【表 234】

{Table 23 4 }

実施例 364

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-メタノール-ジエチルエーテル

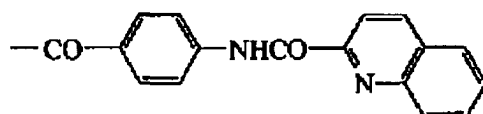
融点 : 194 - 197℃

形態 : 遊離

実施例 365

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0940】

[0940]

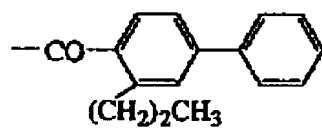
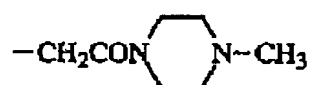
【表 235】

{Table 23 5 }

実施例 366

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

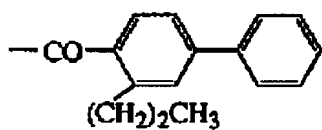
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 367

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0941】

[0941]

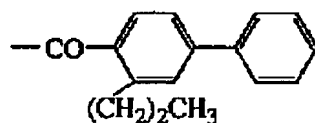
【表 236】

{Table 23 6 }

実施例 368

構造

R :

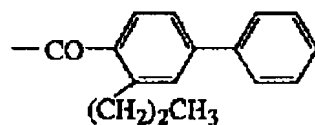
X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 134 - 136℃
形態 : 遊離

実施例 369

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 97 - 100℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0942】

[0942]

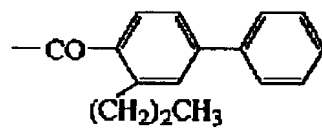
【表 237】

{Table 23 7 }

実施例 370

構造

R :

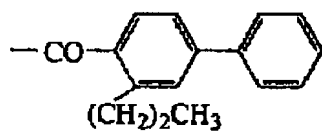
X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 371

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0943】

[0943]

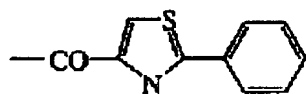
【表 238】

{Table 23 8 }

実施例 372

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-n-ヘキサン

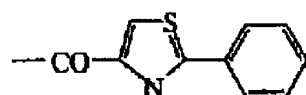
融点 : 135 - 138℃

形態 : 遊離

実施例 373

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 136 - 139℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0944】

[0944]

【表 239】

{Table 23 9 }

実施例 374

構造

R :

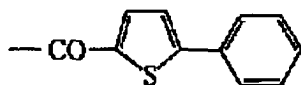
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-酢酸エチル
融点 : 143 - 145℃
形態 : 遊離

実施例 375

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0945】

[0945]

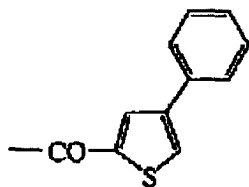
【表 240】

{Table 24 0 }

実施例 376

構造

R :

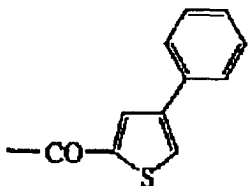
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-酢酸エチル
融点 : 123 - 125°C
形態 : 遊離

実施例 377

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0946】

[0946]

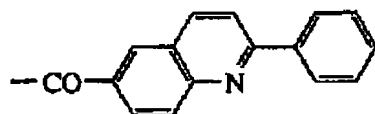
【表 241】

{Table 24 1 }

実施例 378

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサノン酢酸エチル

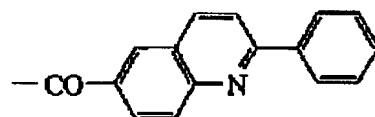
融点 : 164 - 166℃

形態 : 遊離

実施例 379

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0947】

[0947]

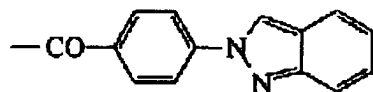
【表 242】

{Table 24 2 }

実施例 380

構造

R :

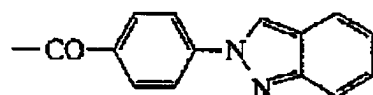
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 168 - 170℃
形態 : 遊離

実施例 381

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン
融点 : 226 - 229℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0948】

[0948]

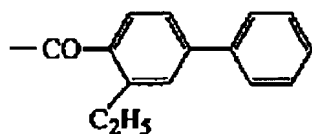
【表 243】

{Table 24 3 }

実施例 382

構造

R :

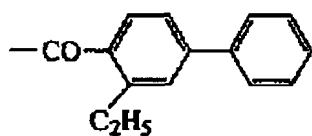
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 131 - 134℃
形態 : 遊離

実施例 383

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0949】

[0949]

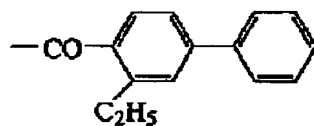
【表 244】

{Table 24 4 }

実施例 384

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

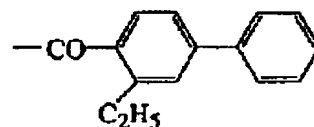
融点 : 133 - 134.5℃

形態 : 遊離

実施例 385

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0950】

[0950]

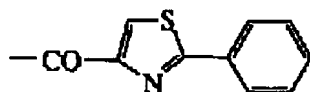
【表 245】

{Table 24 5 }

実施例 386

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² :

CC(C)C(=O)NCCN(CC)CC
R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

実施例 387

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0951】

[0951]

【表 246】

{Table 24 6 }

実施例 388

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

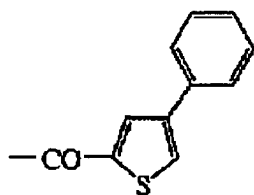
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 389

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0952】

[0952]

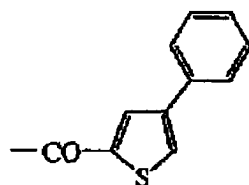
【表 247】

{Table 24 7 }

実施例 390

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

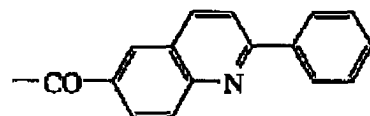
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 391

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0953】

[0953]

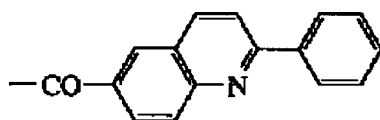
【表 248】

{Table 24 8 }

実施例 392

構造

R :

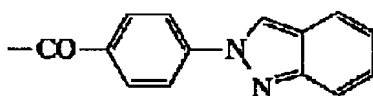
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 393

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0954】

[0954]

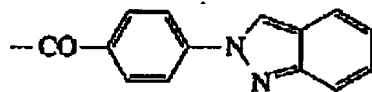
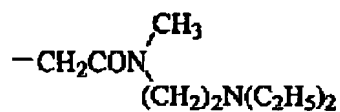
【表 249】

{Table 24 9 }

実施例 394

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

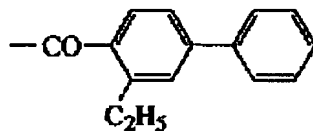
結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 395

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 134 - 135.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0955】

[0955]

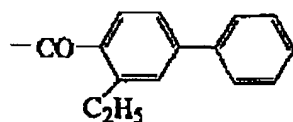
【表 250】

{Table 25 0 }

実施例 396

構造

R :

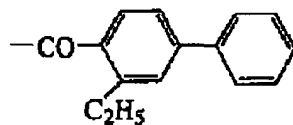
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色針状
 再結晶溶媒 : n-ヘキサン
 融点 : 108 - 110.5℃
 形態 : 遊離

実施例 397

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0956】

[0956]

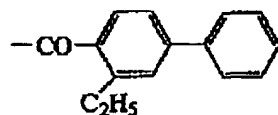
【表 251】

{Table 25 1 }

実施例 398

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

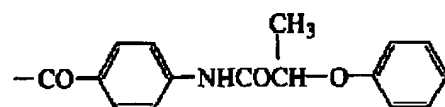
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 399

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 131 - 133℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0957】

[0957]

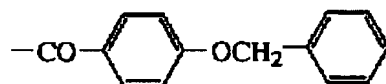
【表 252】

{Table 25 2 }

実施例 400

構造

R :

X : $\text{--CH}_2\text{--}$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色鱗片状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 125 - 126℃

形態 : 遊離

実施例 401

構造

R :

X : $\text{--CH}_2\text{--}$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 134 - 135℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0958】

[0958]

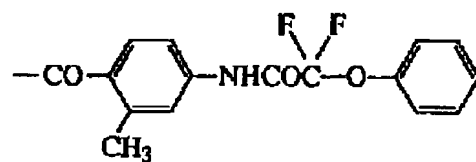
【表 253】

{Table 25 3 }

実施例 402

構造

R :

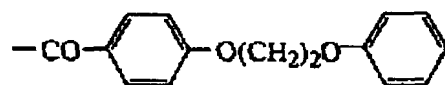
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 190 - 192℃
形態 : 遊離

実施例 403

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 139 - 142℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0959】

[0959]

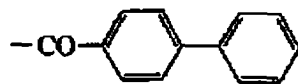
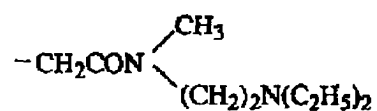
【表 254】

{Table 25 4 }

実施例 404

構造

R :

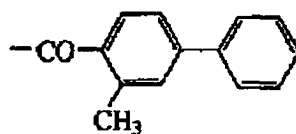
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-FR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 405

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² 及び R³ : = O

結晶形 : 淡褐色粉末状
融点 : 157 - 159℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0960】

[0960]

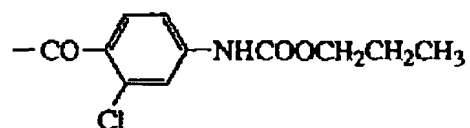
【表 255】

{Table 25 5 }

実施例 406

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール

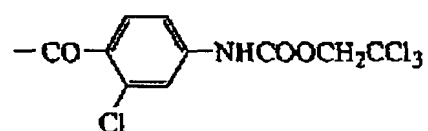
融点 : 166 - 167°C

形態 : 遊離

実施例 407

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 181 - 182°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0961】

[0961]

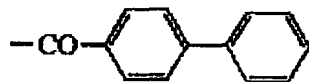
【表 256】

{Table 25 6 }

実施例 408

構造

R :

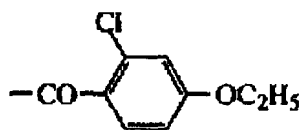
X : -CH2-R¹ : 7-FR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 409

構造

R :

X : -CH2-R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 108 - 109℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0962】

[0962]

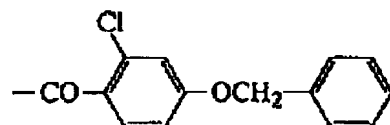
【表 257】

{Table 25 7 }

実施例 410

構造

R :

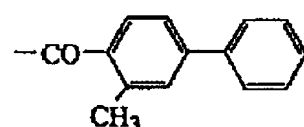
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 104 - 106℃
形態 : 遊離

実施例 411

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム - ジエチルエーテル
融点 : 130 - 132℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0963】

[0963]

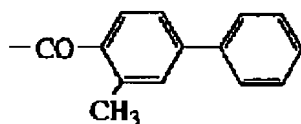
【表 258】

{Table 25 8 }

実施例 412

構造

R :

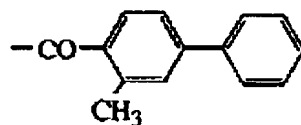
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{OH}$ R³ : H

結晶形 : 淡褐色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 191 - 193℃
形態 : 遊離

実施例 413

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{OCH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0964】

[0964]

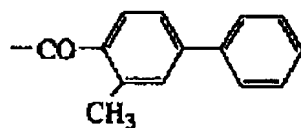
【表 259】

{Table 25 9 }

実施例 414

構造

R :

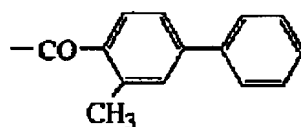
X : -CH₂-R¹ : HR² 及び R³: -CH₂

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-n-ヘキサン
融点 : 123 - 124℃
形態 : 遊離

実施例 415

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : -OHR³ : -CH₂OH

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0965】

[0965]

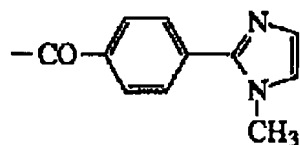
【表 260】

{Table 26 0 }

実施例 416

構造

R :

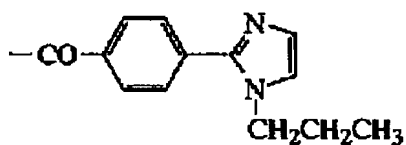
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 194 - 197℃
形態 : 遊離

実施例 417

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0966】

[0966]

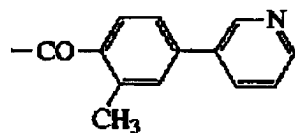
【表 261】

{Table 26 1 }

実施例 418

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

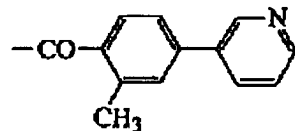
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 419

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0967】

[0967]

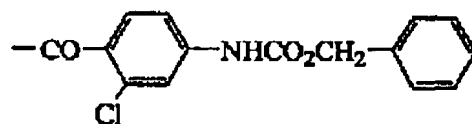
【表 262】

{Table 26 2 }

実施例 420

構造

R :

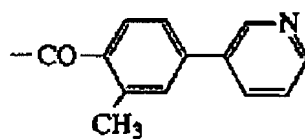
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 421

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡褐色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0968】

[0968]

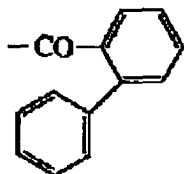
【表 263】

{Table 26 3 }

実施例 422

構造

R :

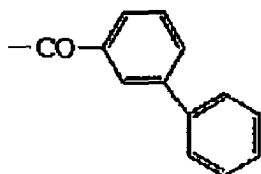
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
形態 : 遊離

実施例 423

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0969】

[0969]

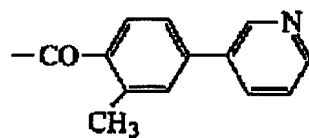
【表 264】

{Table 26 4 }

実施例 424

構造

R :

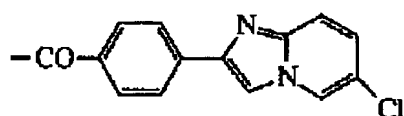
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 425

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0970】

[0970]

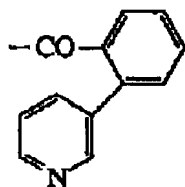
【表 265】

{Table 26 5 }

実施例 426

構造

R :

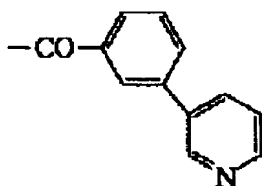
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡褐色不定形
形態 : 遊離

実施例 427

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 223 - 227°C
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0971】

[0971]

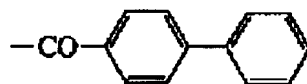
【表 266】

{Table 26 6 }

実施例 428

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

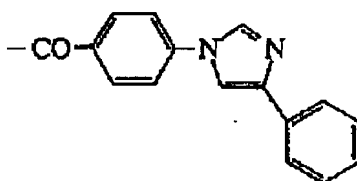
融点 : 152 - 154°C

形態 : 遊離

実施例 429

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 166 - 168°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0972】

[0972]

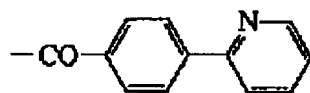
【表 267】

{Table 26 7 }

実施例 430

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

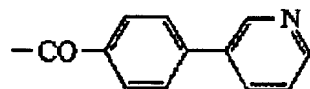
融点 : 190 - 192℃

形態 : 遊離

実施例 431

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 185 - 187℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0973】

[0973]

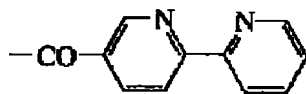
【表 268】

{Table 26 8 }

実施例 432

構造

R :

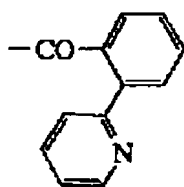
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡褐色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 154 - 158℃
形態 : 遊離

実施例 433

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡褐色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0974】

[0974]

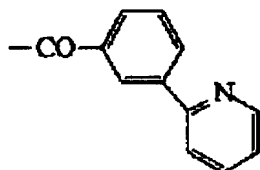
【表 269】

{Table 26 9 }

実施例 434

構造

R :

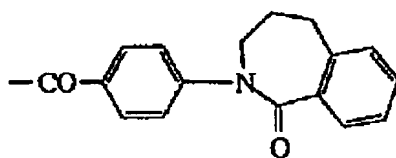
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
 融点 : 222 - 225℃
 形態 : HCl

実施例 435

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色プリズム状
 再結晶溶媒 : エタノール-ジクロロメタン-ジエチルエーテル
 融点 : 199 - 201℃
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0975】

[0975]

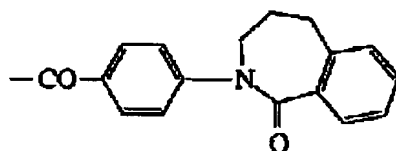
【表 270】

{Table 27 0 }

実施例 436

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

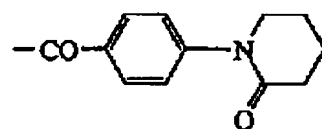
結晶形 : 無色粘稠油

形態 : 遊離

実施例 437

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 173 - 175°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0976】

[0976]

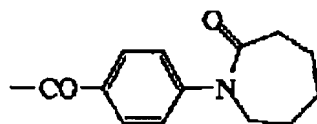
【表 271】

{Table 27 1 }

実施例 438

構造

R :

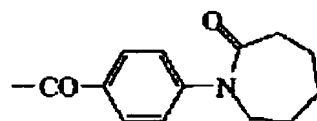
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 439

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 218 - 219℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0977】

[0977]

【表 272】

{Table 27 2 }

実施例 440

構造

R :

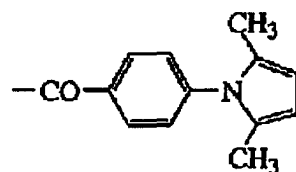
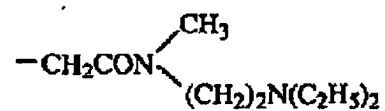
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 黄色粘稠油
形態 : 遊離

実施例 441

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 黄色油状
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0978】

[0978]

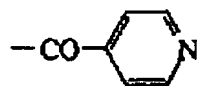
【表 273】

{Table 27 3 }

実施例 442

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

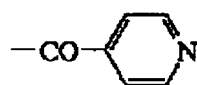
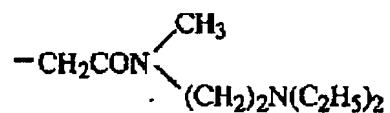
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 143 - 145℃

実施例 443

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

JP1997221476A

1997-8-26

【0979】

[0979]

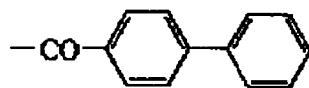
【表 274】

{Table 27 4 }

実施例 444

構造

R :

X : $\text{--CH}_2\text{--}$ R¹ : 7-FR² : OHR³ : H

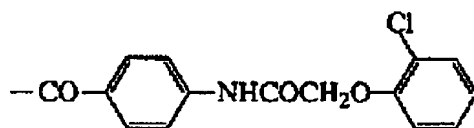
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

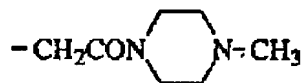
実施例 445

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0980】

[0980]

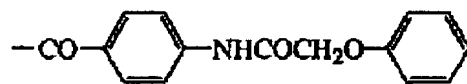
【表 275】

{Table 27 5 }

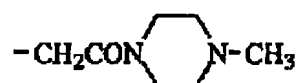
実施例 446

構造

R :



X : 単結合

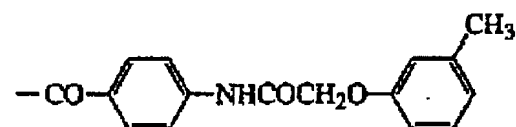
R¹ : 6-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

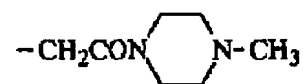
実施例 447

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0981】

[0981]

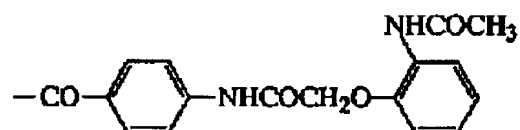
【表 276】

{Table 27 6 }

実施例 448

構造

R :



X : 単結合

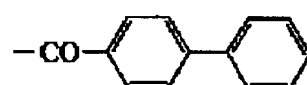
R¹ : 6-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 449

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONHCH}_2\text{CONH}_2$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 208 - 209℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0982】

[0982]

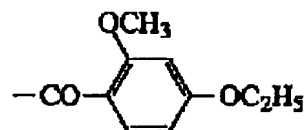
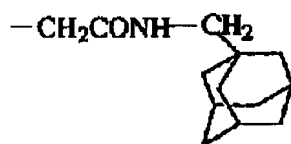
【表 277】

{Table 27 7 }

実施例 450

構造

R :

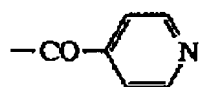
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 451

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 222 - 224℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0983】

[0983]

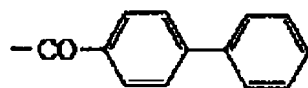
【表 278】

{Table 27 8 }

実施例 452

構造

R :

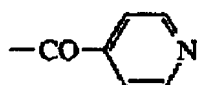
X : -CH₂-R¹ : 7-FR² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色鱗片状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 97 - 100℃
形態 : 遊離

実施例 453

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 116 - 118℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0984】

[0984]

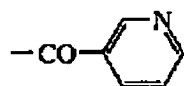
【表 279】

{Table 27 9 }

実施例 454

構造

R :

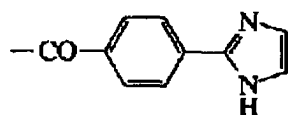
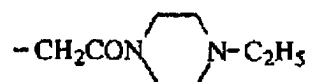
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 115 - 116℃
形態 : 遊離

実施例 455

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0985】

[0985]

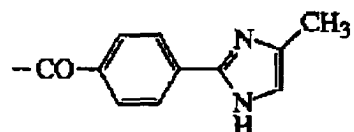
【表 280】

{Table 28 0 }

実施例 456

構造

R :

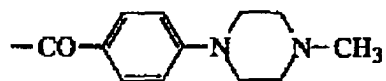
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

実施例 457

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル-n-ヘキサン
融点 : 194 - 197℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0986】

[0986]

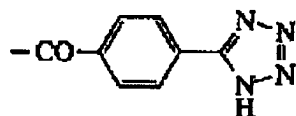
【表 281】

{Table 28 1 }

実施例 458

構造

R :

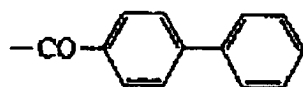
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡褐色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 150 - 154℃
形態 : 遊離

実施例 459

構造

R :



X : 単結合

R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0987】

[0987]

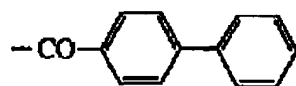
【表 282】

{Table 28 2 }

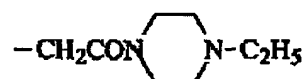
実施例 460

構造

R :



X : 単結合

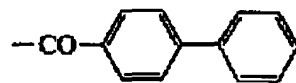
R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 微橙色不定形
形態 : 2HCl

実施例 461

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-ClR² : -CH₂CONH(CH₂)₂N(C₂H₅)₂R³ : H

結晶形 : 微黄色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0988】

[0988]

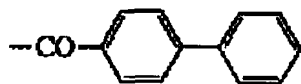
【表 283】

{Table 28 3 }

実施例 462

構造

R :



X : 単結合

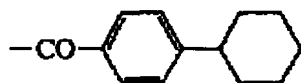
R¹ : 6-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 463

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0989】

[0989]

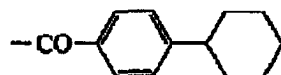
【表 284】

{Table 28 4 }

実施例 464

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-ClR² :R³ : H

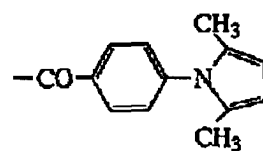
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 465

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 154 - 156℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0990】

[0990]

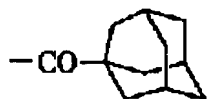
【表 285】

{Table 28 5 }

実施例 466

構造

R :

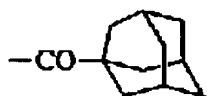
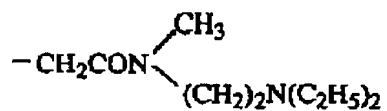
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
 融点 : 195 - 196°C
 形態 : 遊離

実施例 467

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
 形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0991】

[0991]

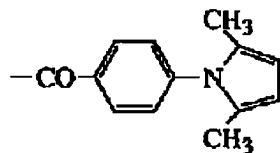
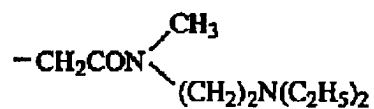
【表 286】

{Table 28 6 }

実施例 468

構造

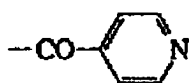
R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

実施例 469

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0992】

[0992]

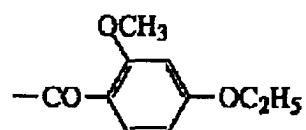
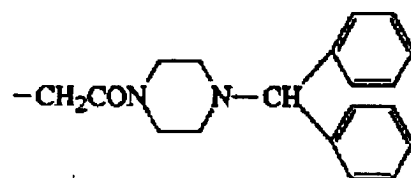
【表 287】

{Table 28 7 }

実施例 470

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

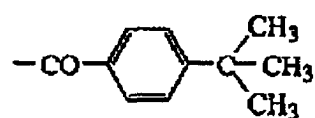
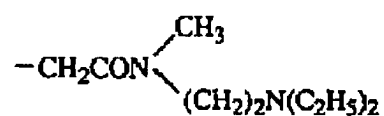
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 471

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0993】

[0993]

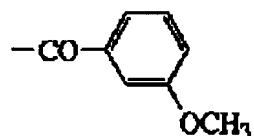
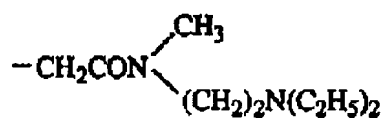
【表 288】

{Table 28 8 }

実施例 472

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

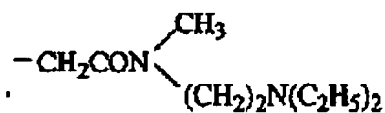
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 473

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0994】

[0994]

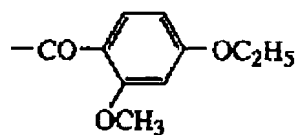
【表 289】

{Table 28 9 }

実施例 474

構造

R :

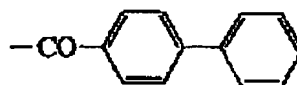
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{NHSO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 158 - 159℃
形態 : 遊離

実施例 475

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{NHSO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 193 - 194℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0995】

[0995]

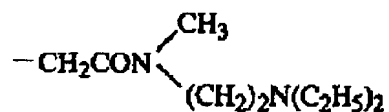
【表 290】

{Table 29 0 }

実施例 476

構造

R :

X : $\text{--CH}_2\text{--}$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

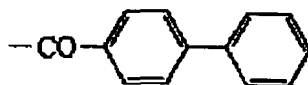
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 477

構造

R :

X : $\text{--CH}_2\text{--}$ R¹ : 7-ClR² : $\text{--CH}_2\text{CONH}_2$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0996】

[0996]

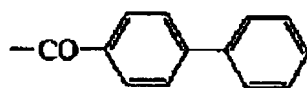
【表 291】

{Table 29 1 }

実施例 478

構造

R :

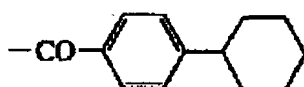
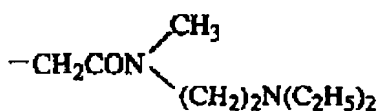
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 479

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0997】

[0997]

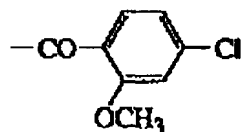
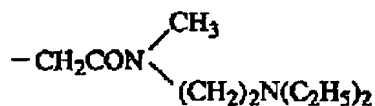
【表 292】

{Table 29 2 }

実施例 480

構造

R :

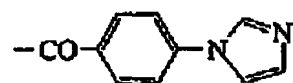
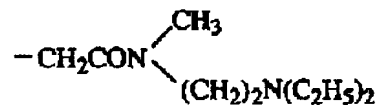
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

実施例 481

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【0998】

[0998]

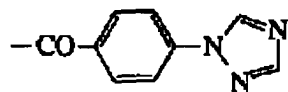
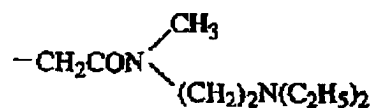
【表 293】

{Table 29 3 }

実施例 482

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

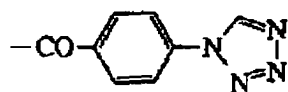
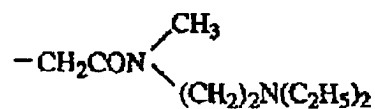
結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

実施例 483

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 155 - 158℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【0999】

[0999]

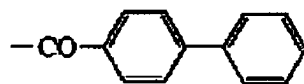
【表 294】

{Table 29 4 }

実施例 484

構造

R :

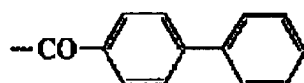
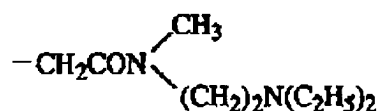
X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 485

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1000】

{1000}

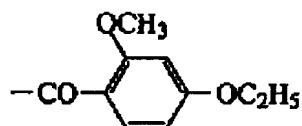
【表 295】

{Table 29 5 }

実施例 486

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

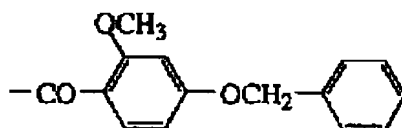
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 487

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1001】

{1001}

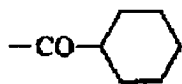
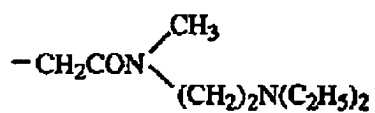
【表 296】

{Table 29 6 }

実施例 488

構造

R :

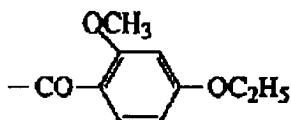
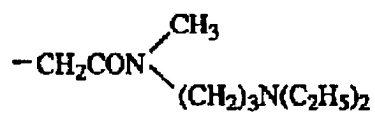
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

実施例 489

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1002】

{1002}

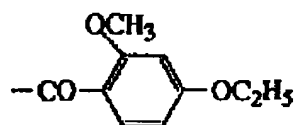
【表 297】

{Table 29 7 }

実施例 490

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

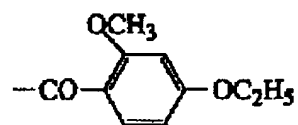
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 491

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1003】

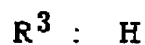
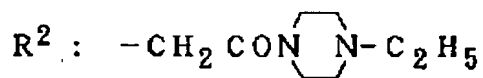
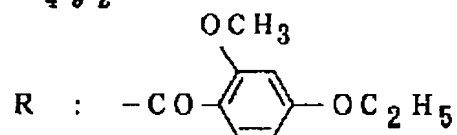
{1003}

【表 298】

{Table 29 8 }

実施例 492

構造

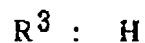
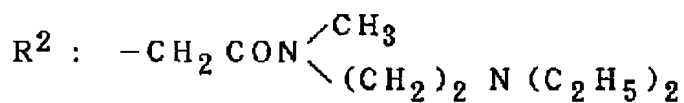
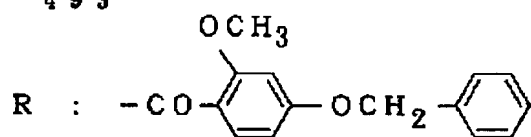


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 493

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1004】

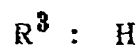
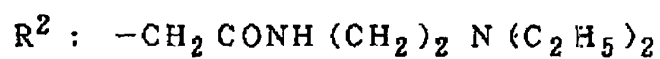
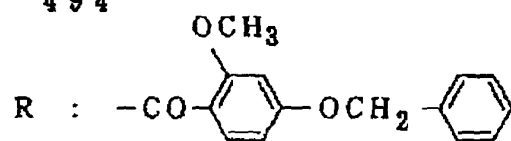
{1004}

【表 299】

{Table 29 9 }

実施例 494

構造

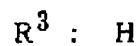
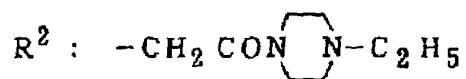
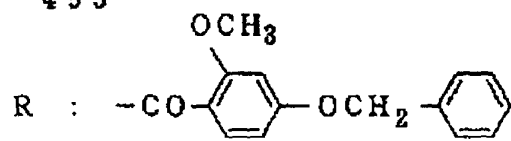


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 495

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1005】

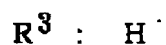
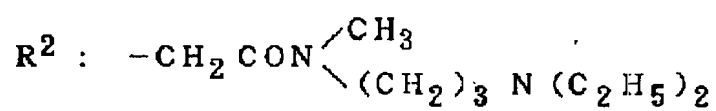
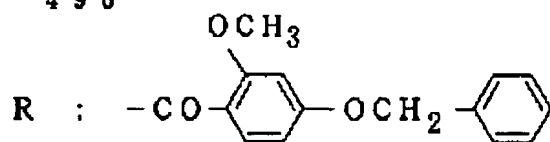
{1005}

【表 300】

{Table 3 00 }

実施例 496

構造

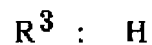
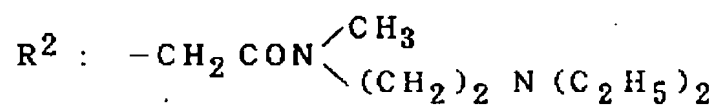
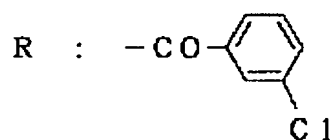


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 497

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1006】

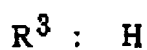
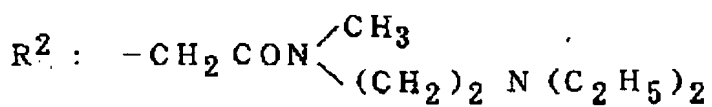
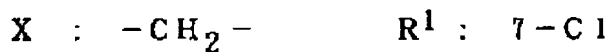
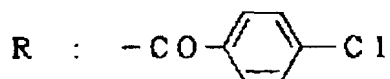
{1006}

【表 301】

{Table 3 01 }

実施例 498

構造

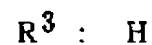
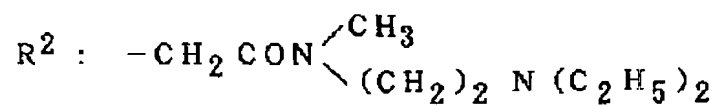
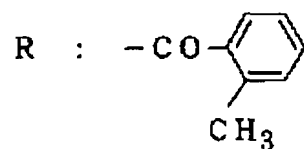


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 499

構造



結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1007】

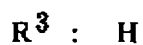
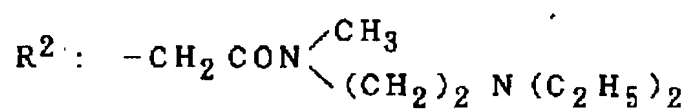
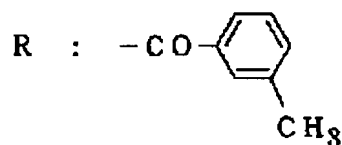
{1007}

【表 302】

{Table 3 02 }

実施例 500

構造

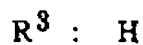
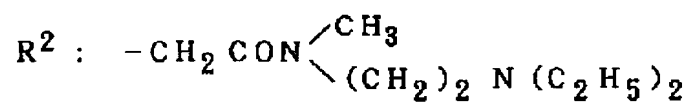
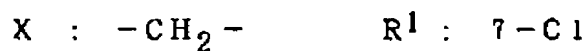
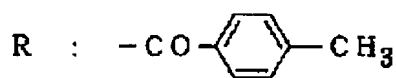


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 501

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1008】

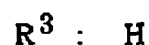
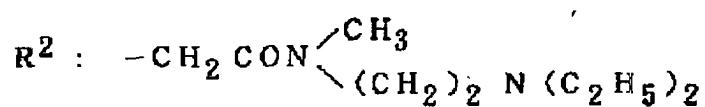
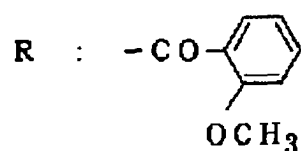
{1008}

【表 303】

{Table 3 03 }

実施例 502

構造

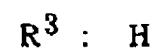
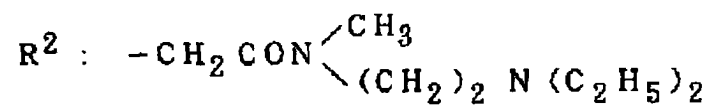
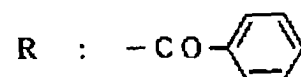


結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

実施例 503

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1009】

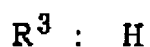
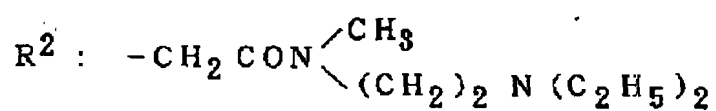
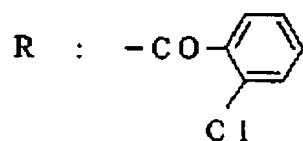
{1009}

【表 304】

{Table 3 04 }

実施例 504

構造

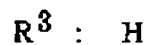
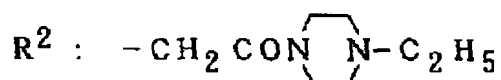
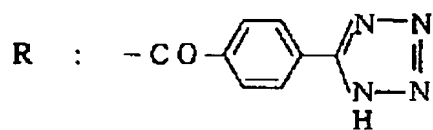


結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

実施例 505

構造



結晶形 : 淡褐色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1010】

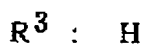
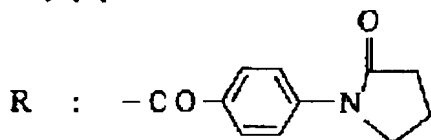
{1010}

【表 305】

{Table 3 05 }

実施例 506

構造



結晶形 : 白色粉末状

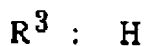
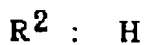
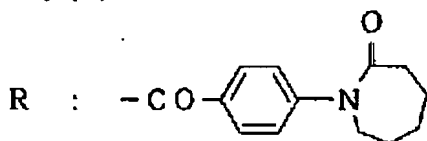
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 209-211℃

形態 : 遊離

実施例 507

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 169-170℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1011】

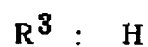
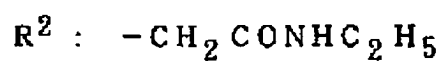
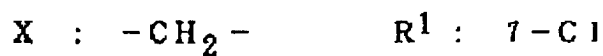
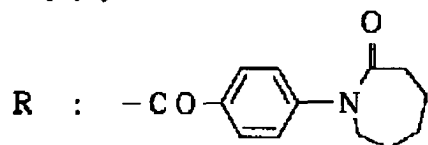
{1011}

【表 306】

{Table 3 06 }

実施例 508

構造

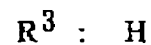
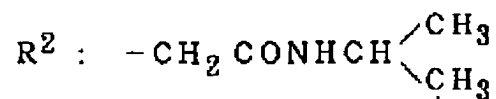
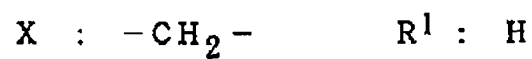
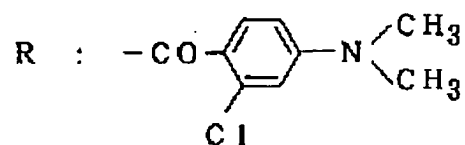


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 509

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1012】

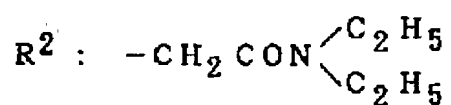
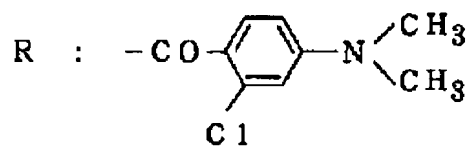
{1012}

【表 307】

{Table 3 07 }

実施例 510

構造

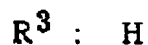
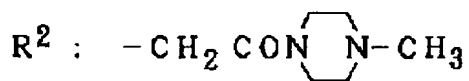
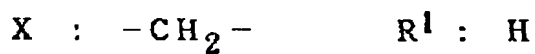
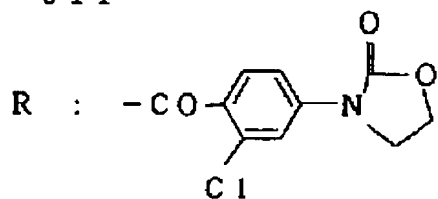


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 511

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1013】

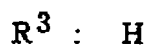
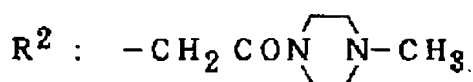
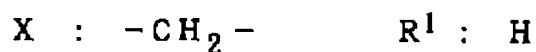
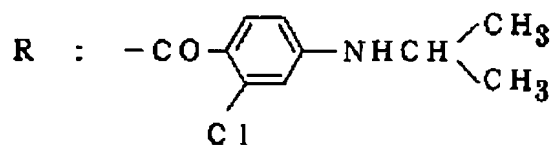
{1013}

【表 308】

{Table 3 08 }

実施例 512

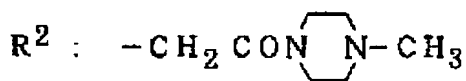
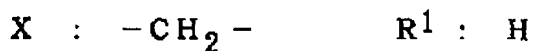
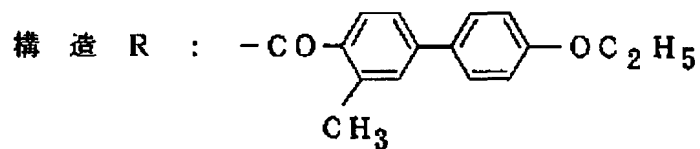
構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 513



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 204-207℃

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

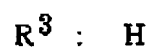
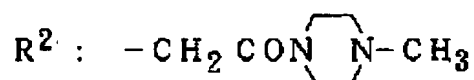
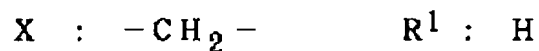
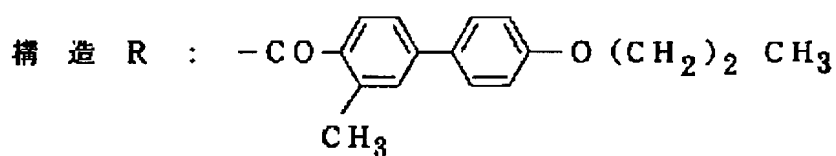
【1014】

{1014}

【表 309】

{Table 3 09 }

実施例 514



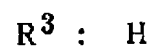
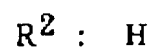
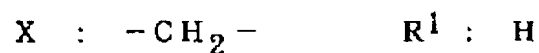
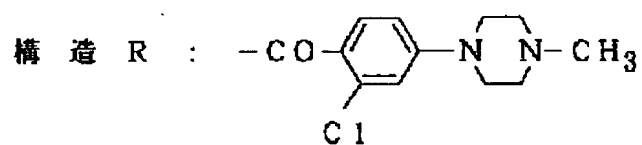
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 217-220℃

形態 : HCl

実施例 515



結晶形 : 黄色針状

再結晶溶媒 : 水

融点 : 198-202℃ (分解)

形態 : HI

JP1997221476A

1997-8-26

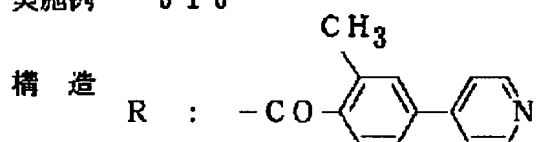
【1015】

{1015}

【表 310】

{Table 3 10 }

実施例 516

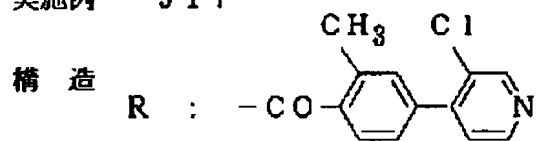
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 517

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

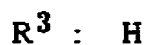
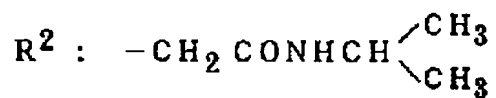
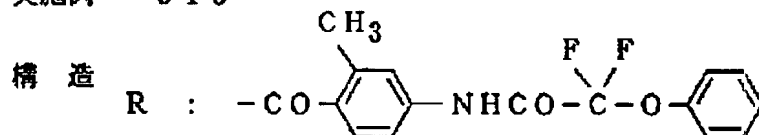
【1016】

{1016}

【表 311】

{Table 3 11 }

実施例 518



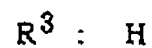
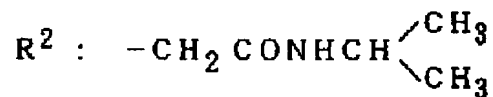
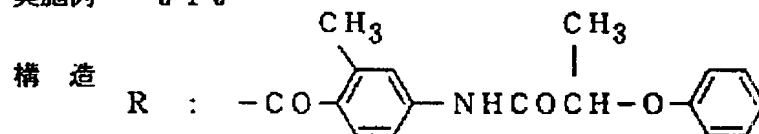
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 154-155℃

形態 : 遊離

実施例 519



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 188-190℃

JP1997221476A

1997-8-26

【1017】

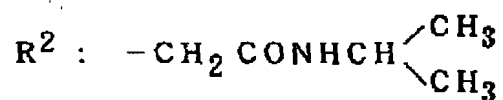
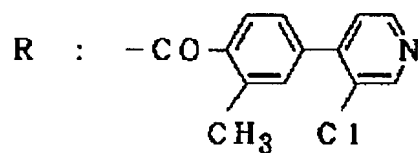
{1017}

【表 312】

{Table 3 12 }

実施例 520

構造

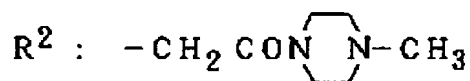
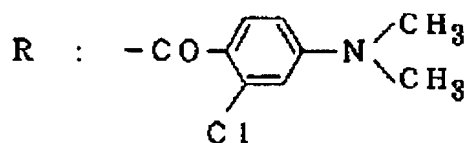


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 521

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

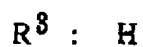
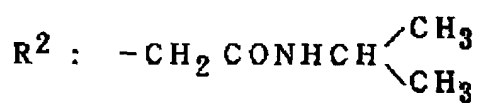
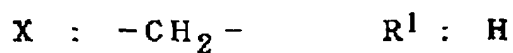
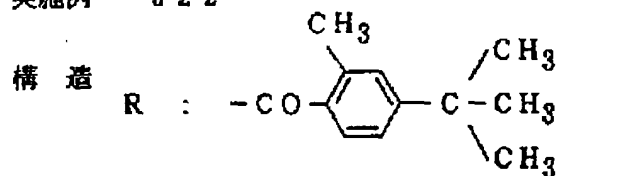
【1018】

{1018}

【表 313】

{Table 3 13 }

実施例 522

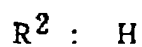
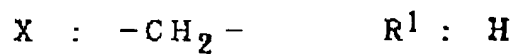
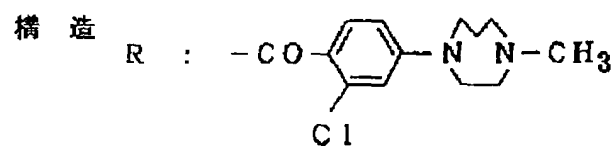


結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 149-151℃

実施例 523



結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1019】

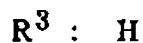
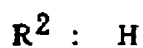
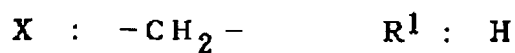
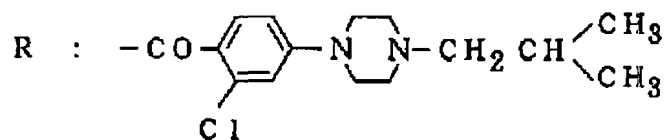
{1019}

【表 314】

{Table 3 14 }

実施例 524

構造

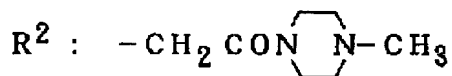
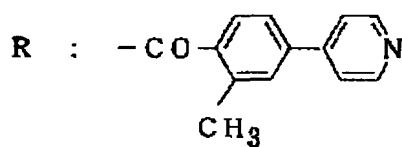


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 525

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1020】

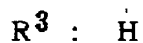
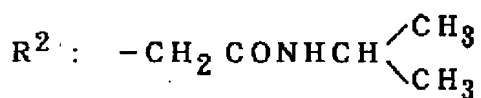
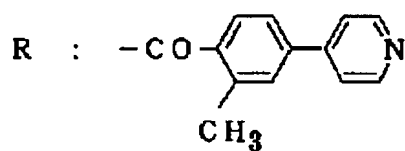
{1020}

【表 315】

{Table 3 15 }

実施例 526

構造

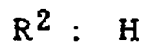
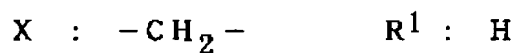
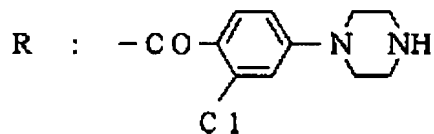


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 527

構造



結晶形 : 褐色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 155-159℃ (分解)

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

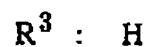
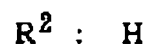
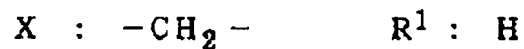
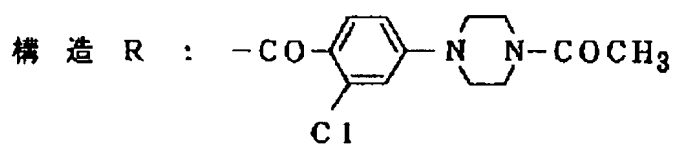
【1021】

{1021}

【表 316】

{Table 3 16 }

実施例 528



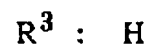
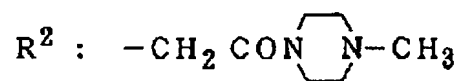
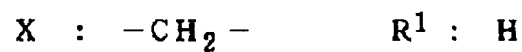
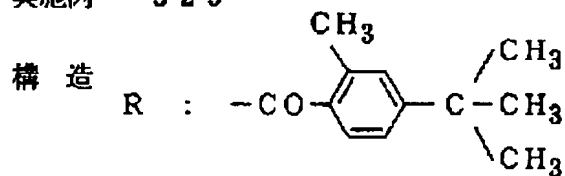
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : $142-145^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 529



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1022】

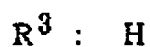
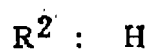
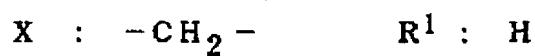
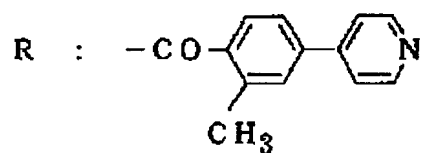
{1022}

【表 317】

{Table 3 17 }

実施例 530

構造



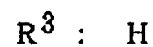
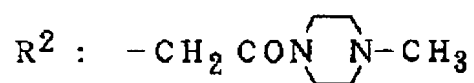
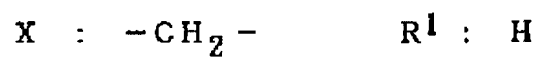
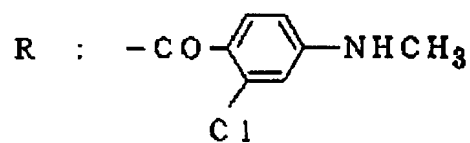
結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

形態 : 遊離

実施例 531

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 2HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1023】

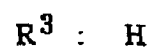
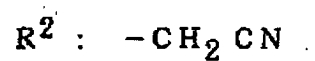
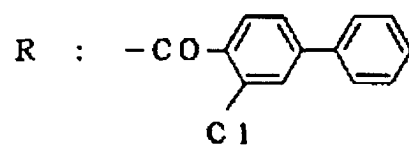
{1023}

【表 318】

{Table 3 18 }

実施例 532

構造

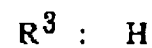
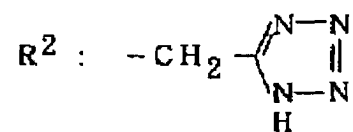
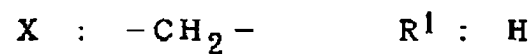
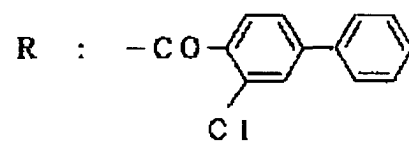


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 533

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 191-194℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1024】

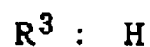
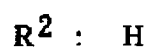
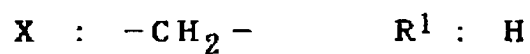
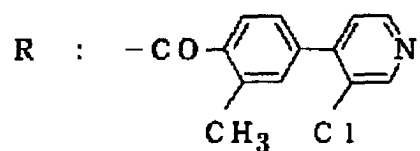
{1024}

【表 319】

{Table 3 19 }

実施例 534

構造

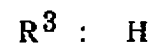
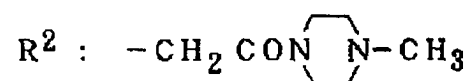
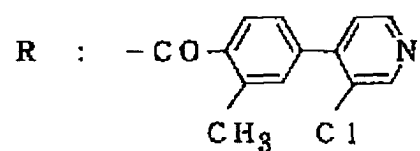


結晶形 : 淡褐色不定形

形態 : 遊離

実施例 535

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1025】

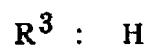
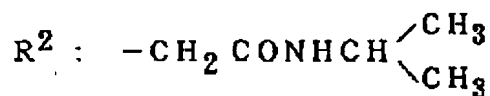
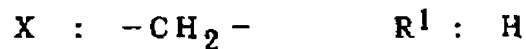
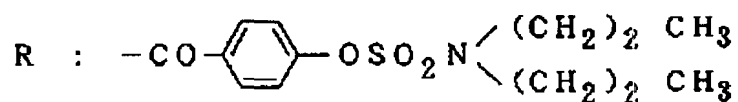
{1025}

【表 320】

{Table 3 20 }

実施例 536

構造



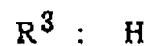
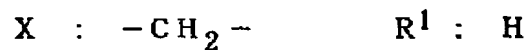
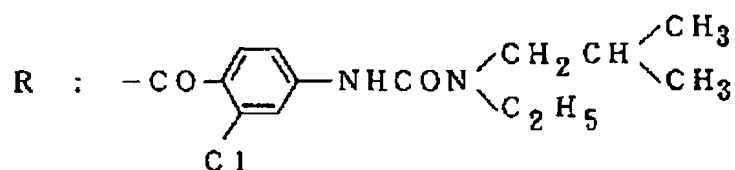
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 146-147℃

実施例 537

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 201-202℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

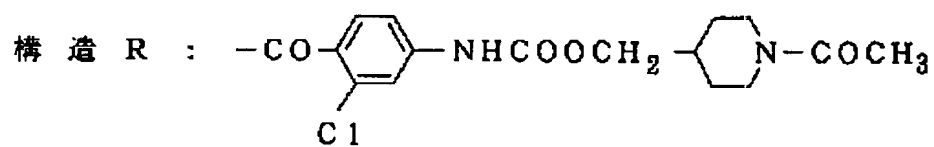
【1026】

{1026}

【表 321】

{Table 3 21 }

実施例 538



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

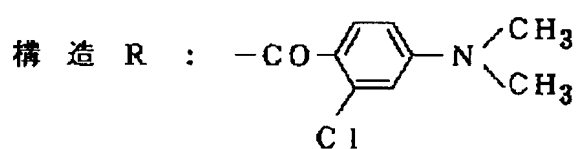
R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : $118-120^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 539



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジイソプロピルエーテル

融点 : $173-174.5^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

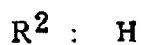
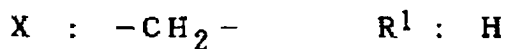
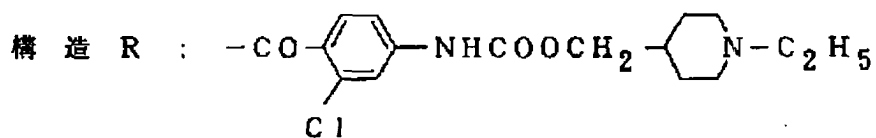
【1027】

{1027}

【表 322】

{Table 3 22 }

実施例 540



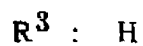
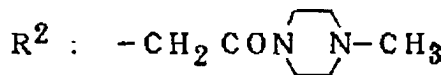
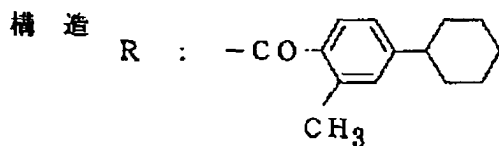
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

融 点 : 159-161℃

形 態 : 遊 離

実施例 541



結 晶 形 : 無色不定形

形 態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1028】

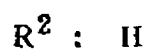
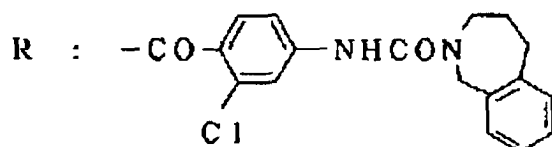
{1028}

【表 323】

{Table 3 23 }

実施例 542

構造

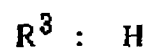
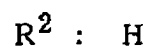
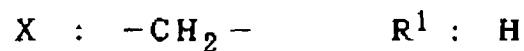
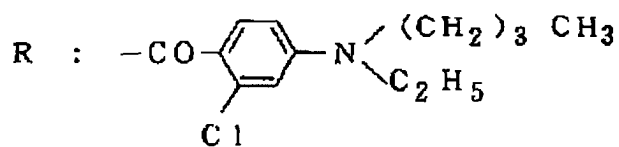


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 543

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン

融点 : 94-95°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

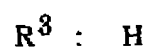
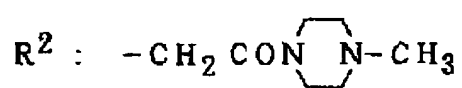
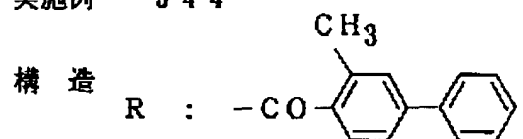
【1029】

{1029}

【表 324】

{Table 3 24 }

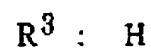
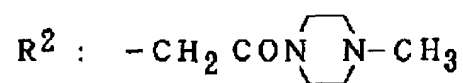
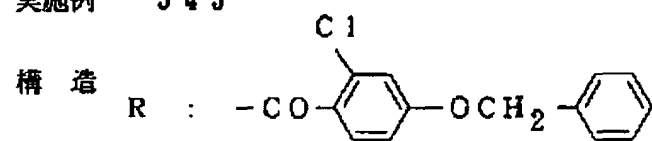
実施例 544



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 545



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1030】

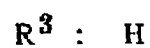
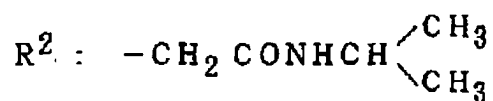
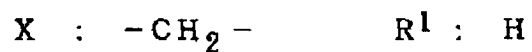
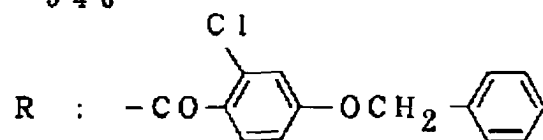
{1030}

【表 325】

{Table 3 25 }

実施例 546

構造



結晶形 : 白色粉末状

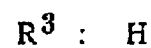
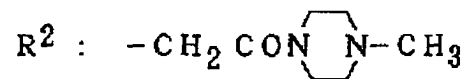
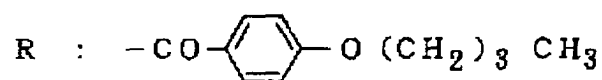
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 174-176℃

形態 : 遊離

実施例 547

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1031】

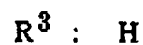
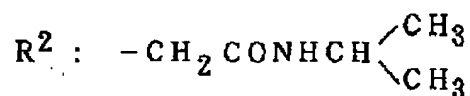
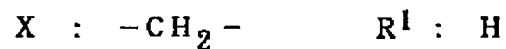
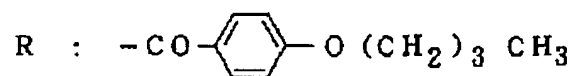
{1031}

【表 326】

{Table 3 26 }

実施例 548

構造



結晶形 : 白色粉末状

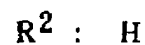
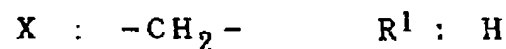
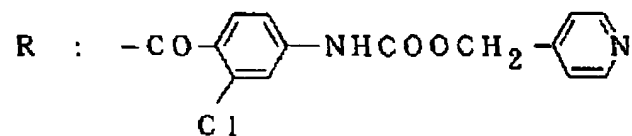
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 133-135℃

形態 : 遊離

実施例 549

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル洗浄

融点 : 181-184℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

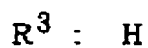
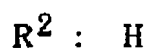
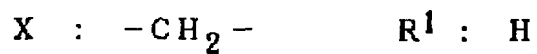
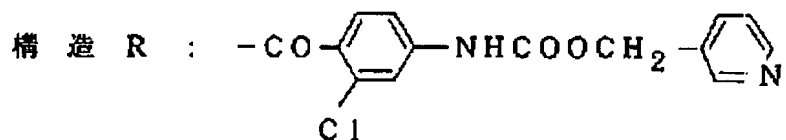
【1032】

{1032}

【表 327】

{Table 3 27 }

実施例 550



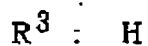
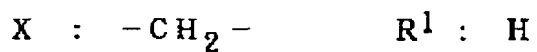
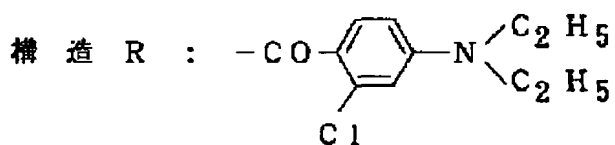
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル洗浄

融 点 : $197-200^\circ\text{C}$

形 態 : 遊 離

実施例 551



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融 点 : $162-163.5^\circ\text{C}$

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

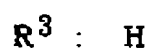
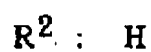
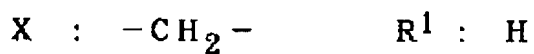
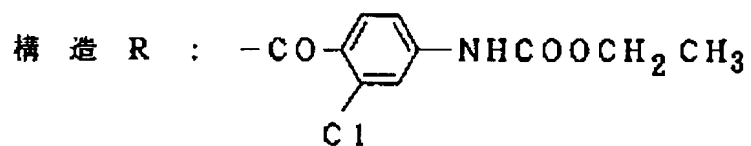
【1033】

{1033}

【表 328】

{Table 3 28 }

実施例 552



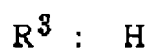
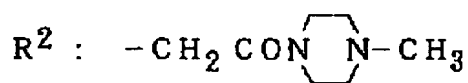
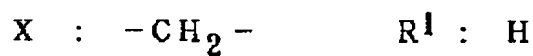
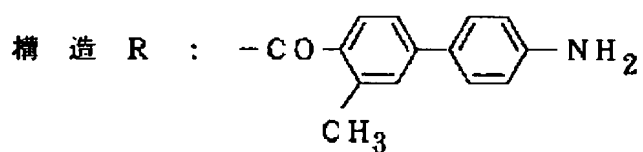
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノールで洗浄

融点 : 168-171℃

形態 : 遊離

実施例 553



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1034】

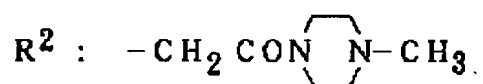
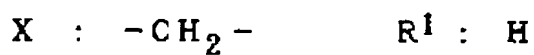
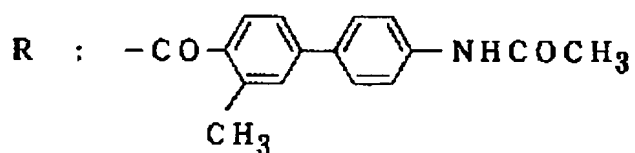
{1034}

【表 329】

{Table 3 29 }

実施例 554

構造

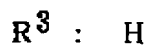
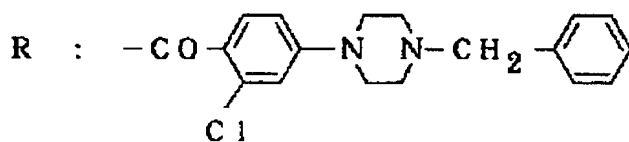


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 555

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

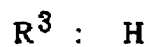
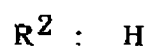
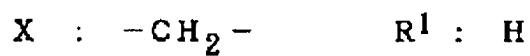
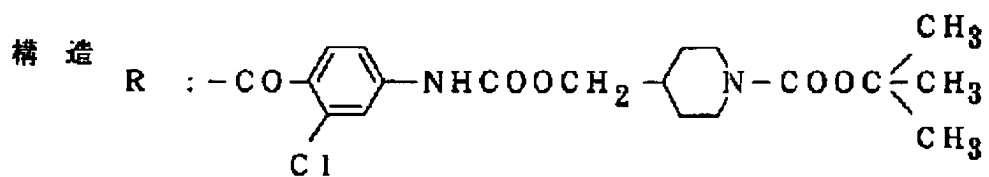
【1035】

{1035}

【表 330】

{Table 3 30 }

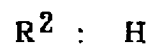
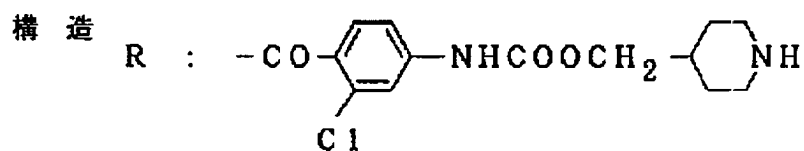
実施例 556



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 557



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : $150-152^\circ\text{C}$

形態 : CF_3COOH

JP1997221476A

1997-8-26

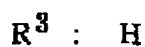
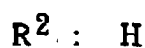
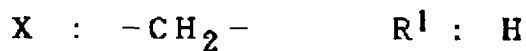
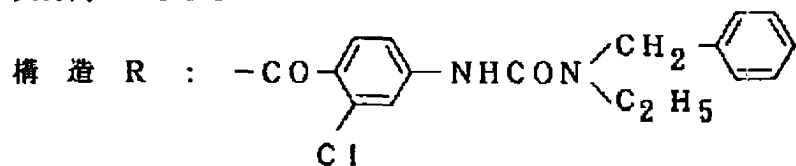
【1036】

{1036}

【表 331】

{Table 3 31 }

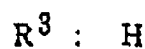
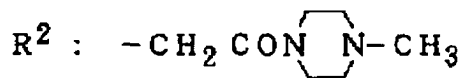
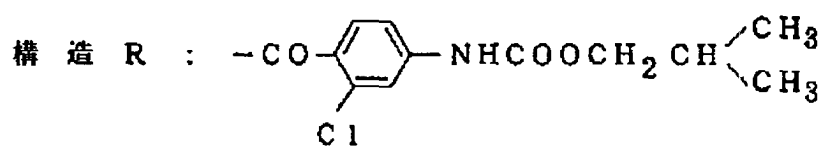
実施例 558



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 559



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジイソプロピルエーテル

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1037】

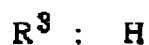
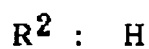
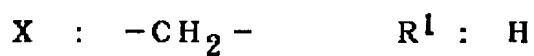
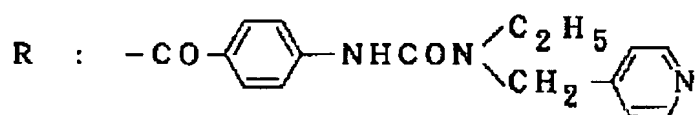
{1037}

【表 332】

{Table 3 32 }

実施例 560

構造

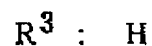
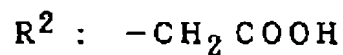
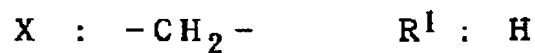
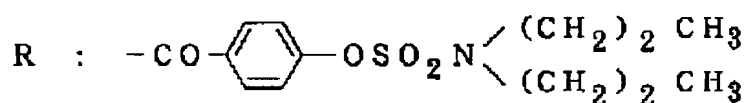


結晶形 : 微橙色不定形

形態 : HCl

実施例 561

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 186-188℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1038】

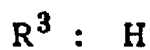
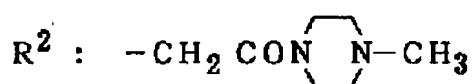
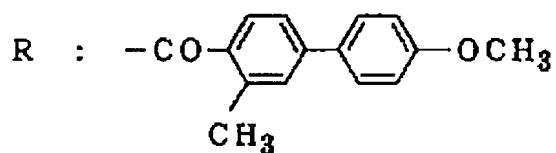
{1038}

【表 333】

{Table 3 33 }

実施例 562

構造

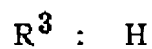
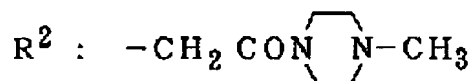
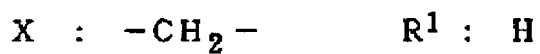
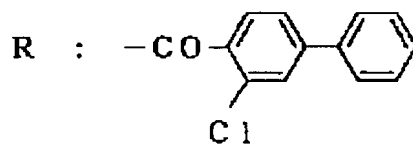


結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 563

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1039】

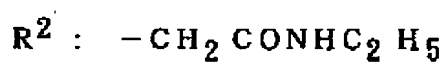
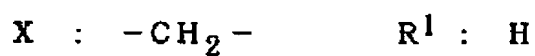
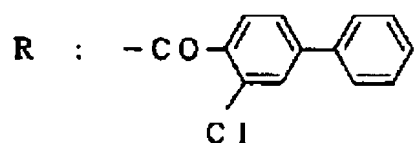
{1039}

【表 334】

{Table 3 34 }

実施例 564

構造

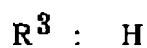
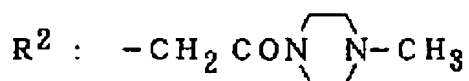
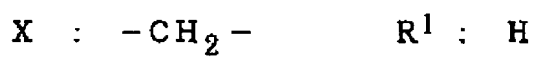
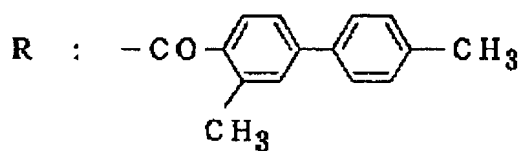


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 565

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1040】

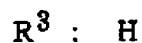
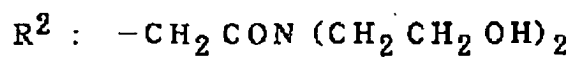
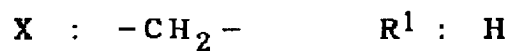
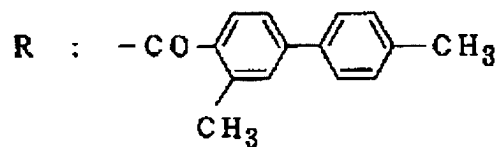
{1040}

【表 335】

{Table 3 35 }

実施例 566

構造

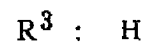
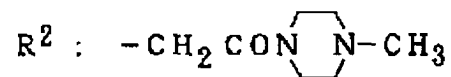
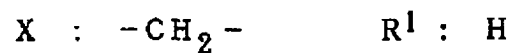
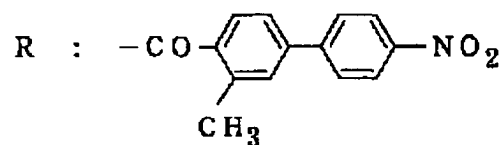


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 567

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

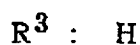
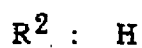
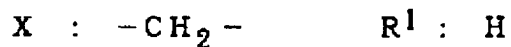
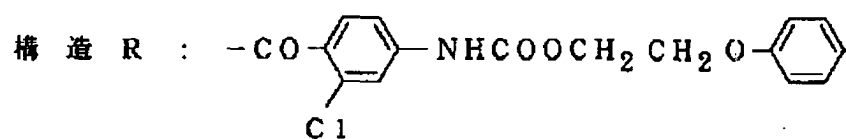
【1041】

{1041}

【表 336】

{Table 3 36 }

実施例 568



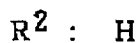
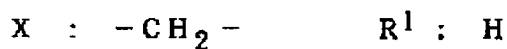
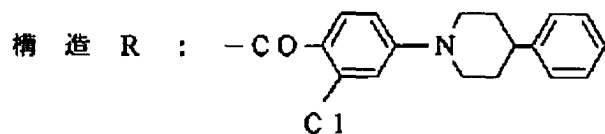
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : $144-146^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 569



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : $128-130^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

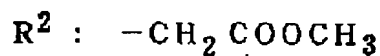
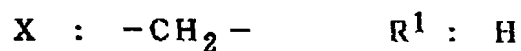
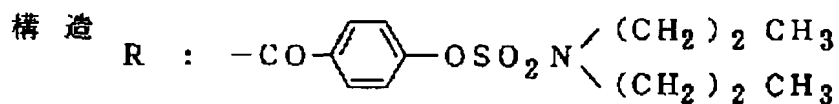
【1042】

{1042}

【表 337】

{Table 3 37 }

実施例 570



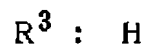
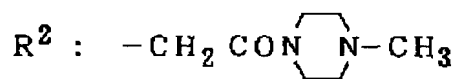
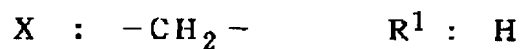
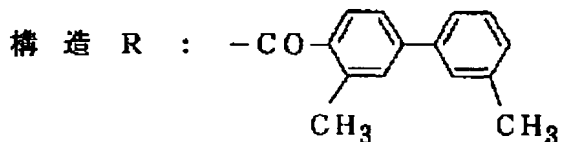
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : $110-111^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 571



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : $161.5-163^\circ\text{C}$

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

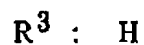
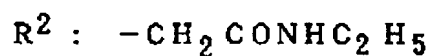
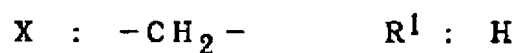
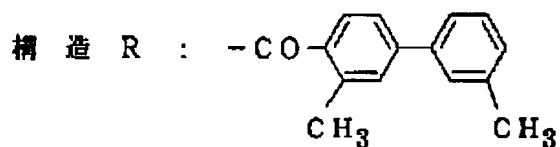
【1043】

{1043}

【表 338】

{Table 3 38 }

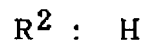
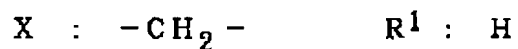
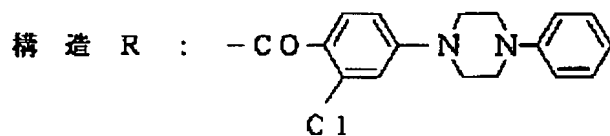
実施例 572



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 573



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジイソプロピルエーテル

融点 : 160 ~ 162 °C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

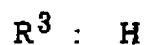
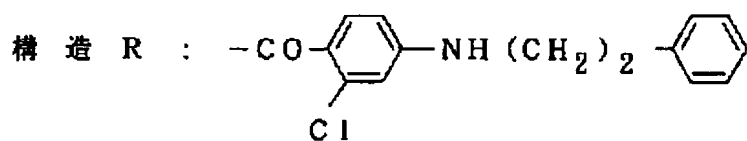
【1044】

{1044}

【表 339】

{Table 3 39 }

実施例 574



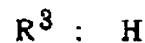
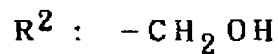
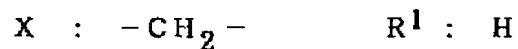
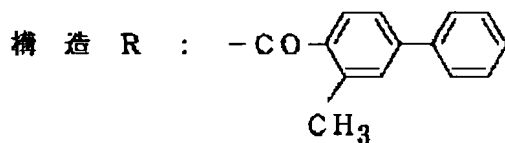
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 108-109℃

形態 : 遊離

実施例 575



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 104-106℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1045】

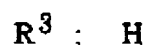
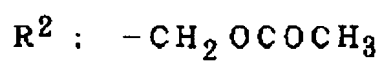
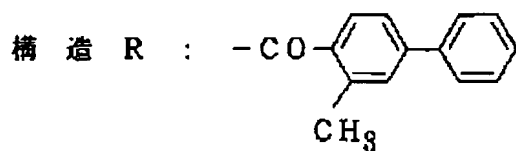
{1045}

【表 340】

{Table 3 40 }

|

実施例 576



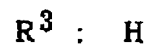
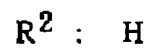
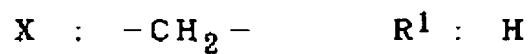
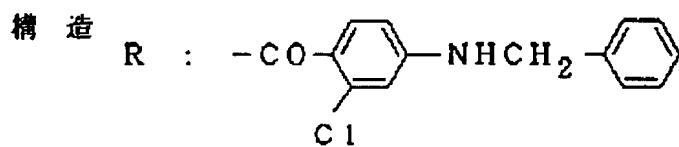
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融 点 : 115-116℃

形 態 : 遊 離

実施例 577



結 晶 形 : 無色不定形

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

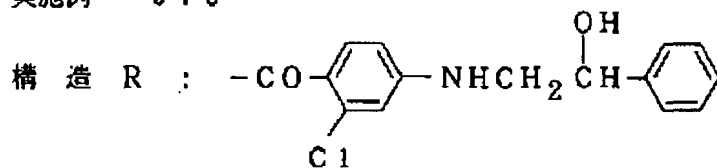
【1046】

{1046}

【表 341】

{Table 3 41 }

実施例 578



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

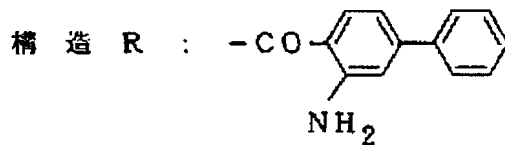
R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 579



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

融点 : 201.5 - 203℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

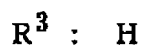
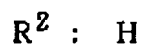
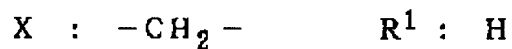
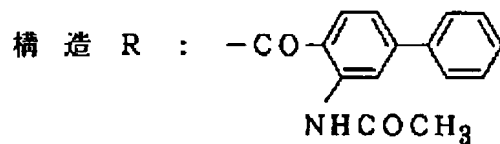
【1047】

{1047}

【表 342】

{Table 3 42 }

実施例 580



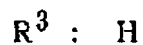
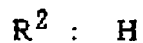
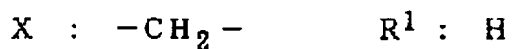
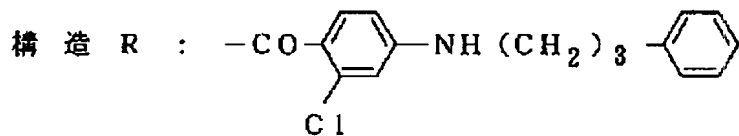
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

融点 : 196-198℃

形態 : 遊離

実施例 581



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-n-ヘキサン

融点 : 130-133℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

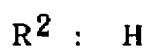
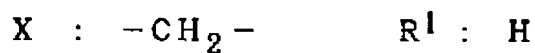
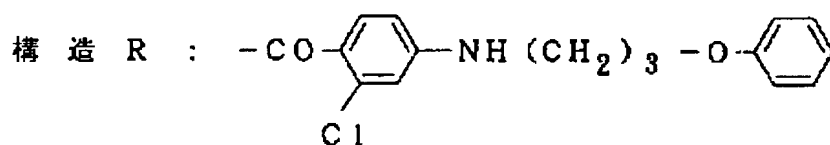
【1048】

{1048}

【表 343】

{Table 3 43 }

実施例 582



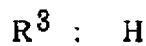
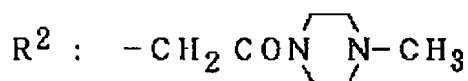
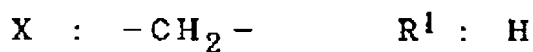
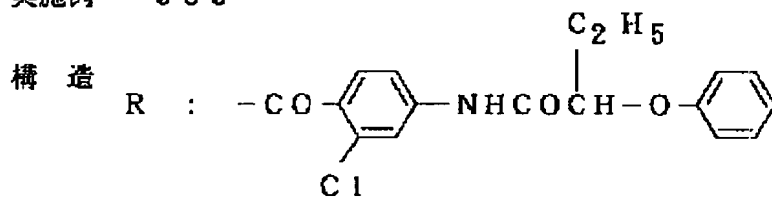
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 125-127℃

形態 : 遊離

実施例 583



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1049】

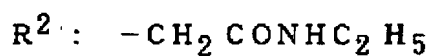
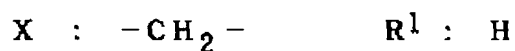
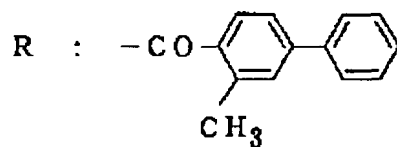
{1049}

【表 344】

{Table 3 44 }

実施例 584

構造

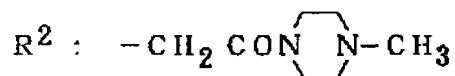
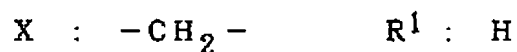
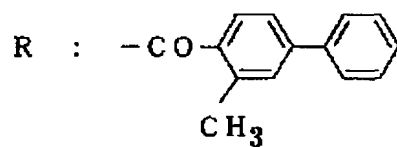


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 585

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1050】

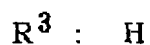
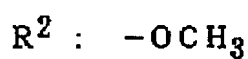
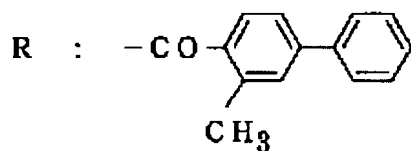
{1050}

【表 345】

{Table 3 45 }

実施例 586

構造

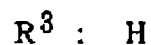
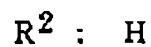
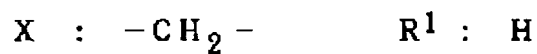
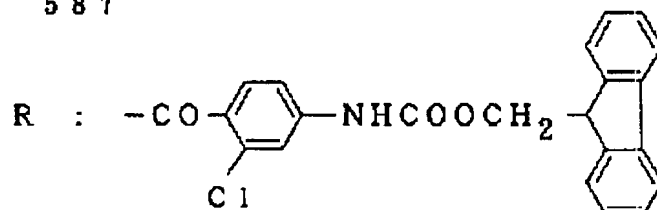


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 587

構造



結晶形 : 白色粉末状

融点 : 196-198℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

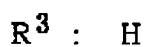
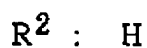
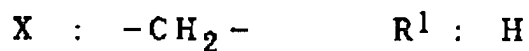
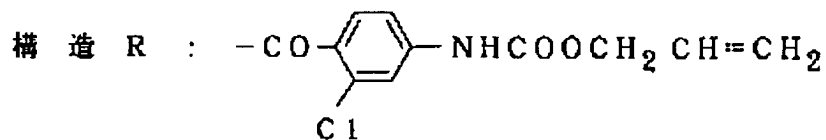
【1051】

{1051}

【表 346】

{Table 3 46 }

実施例 588



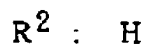
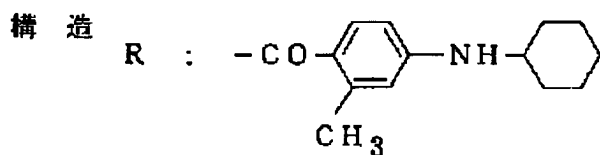
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール

融 点 : $169-170^\circ\text{C}$

形 態 : 遊 離

実施例 589



結 晶 形 : 微黄色不定形

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

【1052】

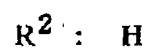
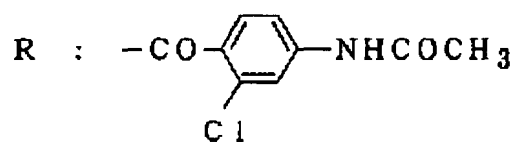
{1052}

【表 347】

{Table 3 47 }

実施例 590

構造



結晶形 : 白色粉末状

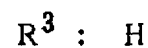
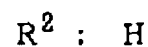
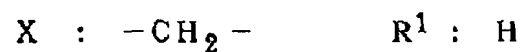
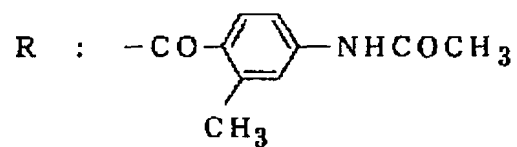
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 218-220℃

形態 : 遊離

実施例 591

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 194-195℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

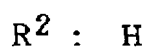
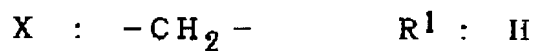
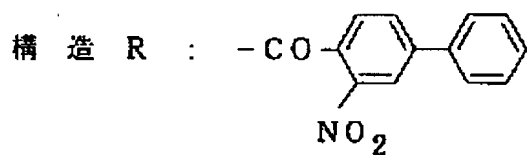
【1053】

{1053}

【表 348】

{Table 3 48 }

実施例 592



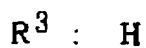
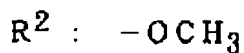
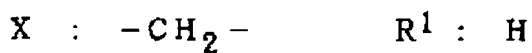
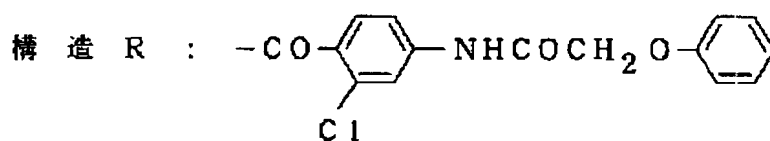
結 晶 形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

融 点 : 158-159℃

形 態 : 遊 離

実施例 593



結 晶 形 : 無色不定形

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

【1054】

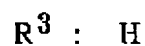
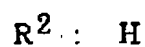
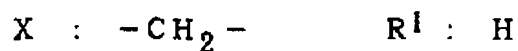
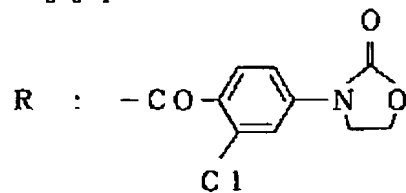
{1054}

【表 349】

{Table 3 49 }

実施例 594

構造

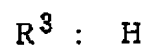
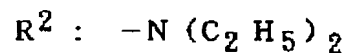
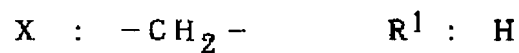
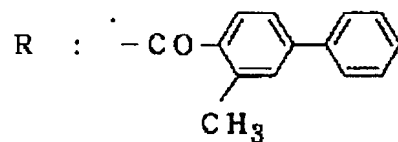


結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 595

構造



結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

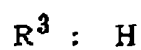
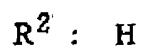
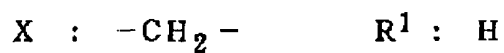
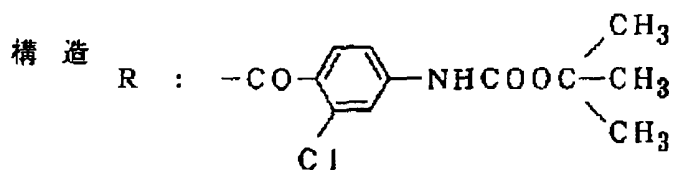
【1055】

{1055}

【表 350】

{Table 3 50 }

実施例 596



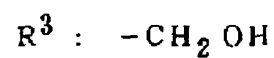
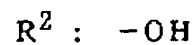
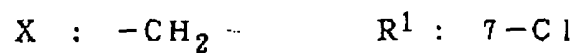
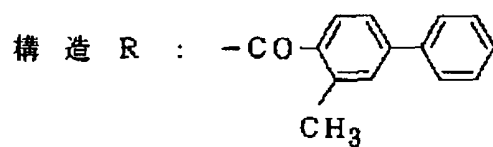
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジイソプロピルエーテル

融 点 : $205-206^\circ\text{C}$

形 態 : 遊 離

実施例 597



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融 点 : $142-144^\circ\text{C}$

形 態 : 遊 離

JP1997221476A

1997-8-26

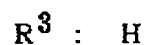
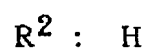
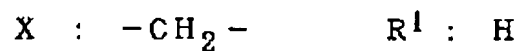
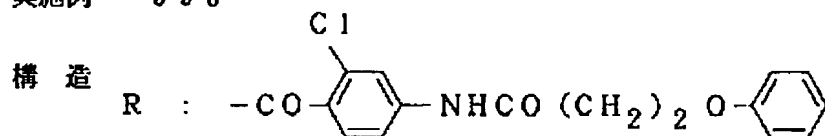
【1056】

{1056}

【表 351】

{Table 3 51 }

実施例 598



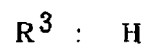
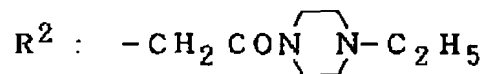
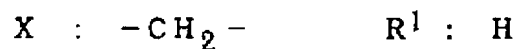
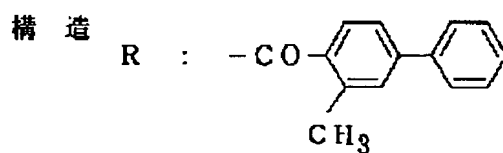
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 132-135℃

形態 : 遊離

実施例 599



結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

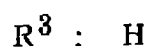
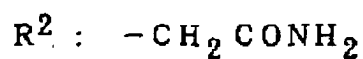
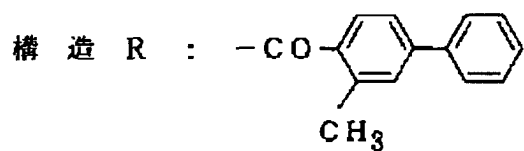
【1057】

{1057}

【表 352】

{Table 3 52 }

実施例 600



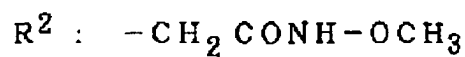
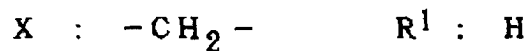
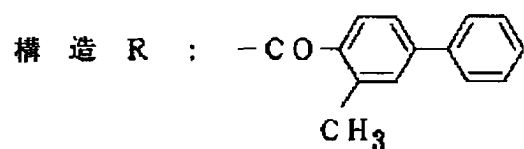
結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : $119-121^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 601



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

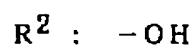
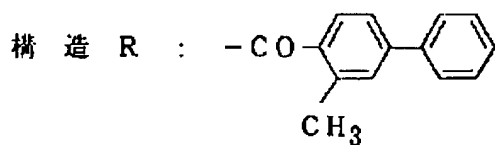
【1058】

{1058}

【表 353】

{Table 3 53 }

実施例 602



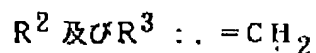
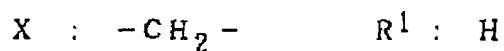
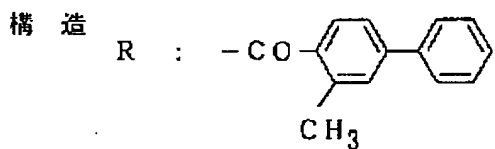
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : $175-178^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 603



結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : ジイソプロピルエーテル-n-ヘキサン

融点 : $113-115^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

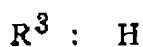
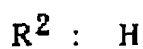
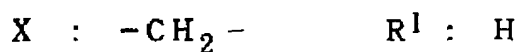
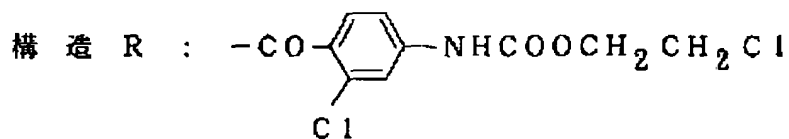
【1059】

{1059}

【表 354】

{Table 3 54 }

実施例 604



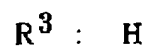
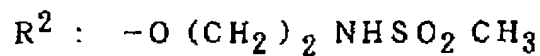
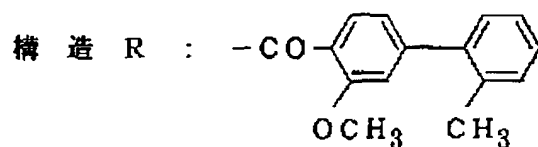
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール洗淨

融点 : $128-130^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 605



結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : $182-183^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1060】

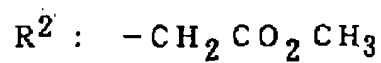
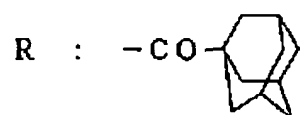
{1060}

【表 355】

{Table 3 55 }

実施例 606

構造

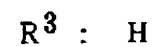
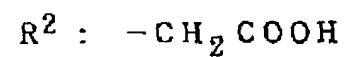
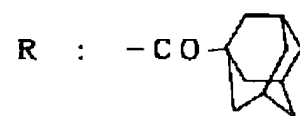


結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

実施例 607

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1061】

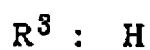
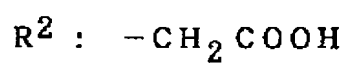
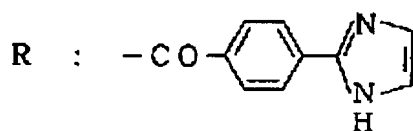
{1061}

【表 356】

{Table 3 56 }

実施例 608

構造

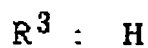
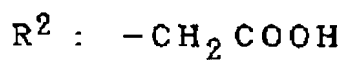
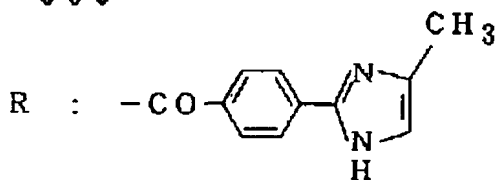


結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 609

構造



結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26


【1062】

{1062}

【表 357】

{Table 3 57 }


実施例 610

構造 R : -CHOX : -CH₂- R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 611

構造 R : -CNX : -CH₂- R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1063】

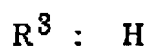
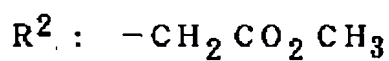
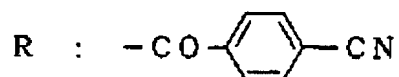
{1063}

【表 358】

{Table 3 58 }

実施例 612

構造



結晶形 : 淡褐色粉末状

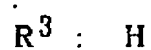
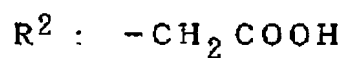
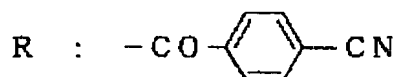
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 149-151℃

形態 : 遊離

実施例 613

構造



結晶形 : 淡褐色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

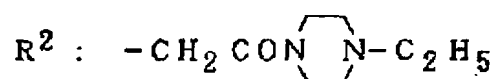
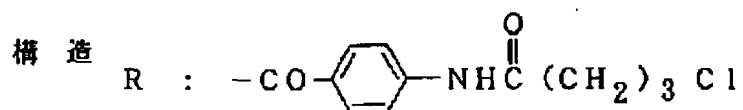
【1064】

{1064}

【表 359】

{Table 3 59 }

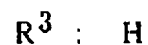
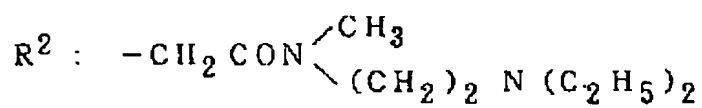
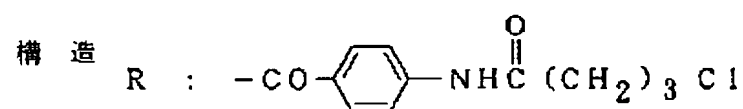
実施例 614



形態 : 遊離

結晶形 : 淡黄色不定形

実施例 615



形態 : 遊離

結晶形 : 無色油状

JP1997221476A

1997-8-26

【1065】

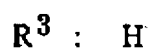
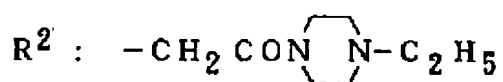
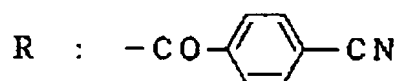
{1065}

【表 360】

{Table 36 0 }

実施例 616

構造

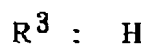
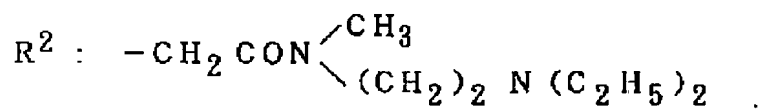
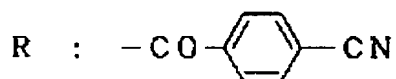


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 617

構造



結晶形 : 淡褐色油状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

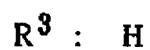
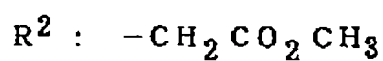
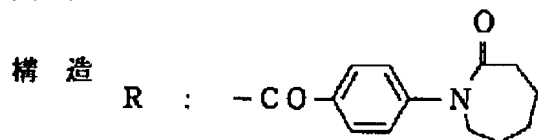
【1066】

{1066}

【表 361】

{Table 36 1 }

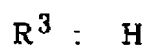
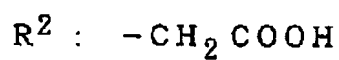
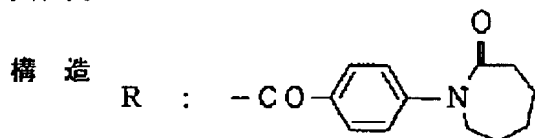
実施例 618



結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

実施例 619



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

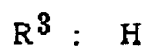
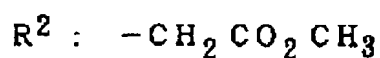
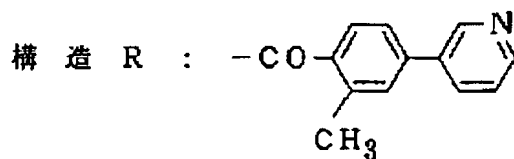
【1067】

{1067}

【表 362】

{Table 36 2 }

実施例 620

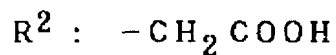
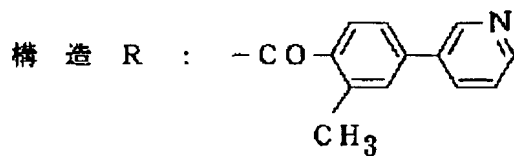


結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 151-161℃

実施例 621



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 258-260℃

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

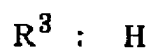
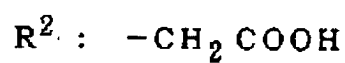
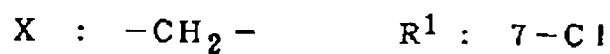
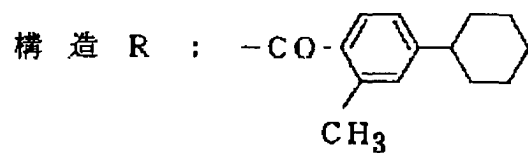
【1068】

{1068}

【表 363】

{Table 36 3 }

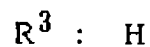
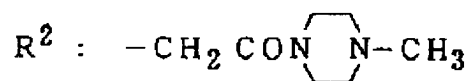
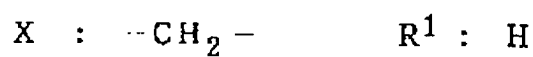
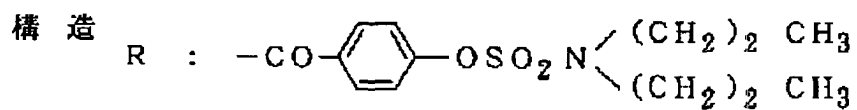
実施例 622



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 623



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1069】

{1069}

【表 364】

{Table 36 4 }

実施例 624

構造 R : $-\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 625

構造 R : $-\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : $188-189^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1070】

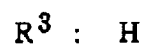
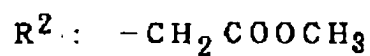
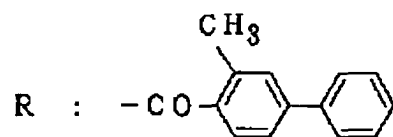
{1070}

【表 365】

{Table 36 5 }

実施例 626

構造

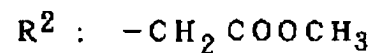
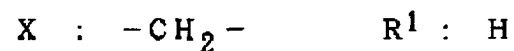
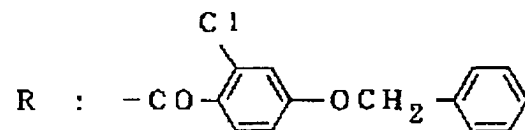


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 627

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

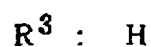
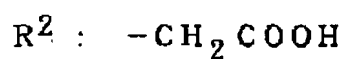
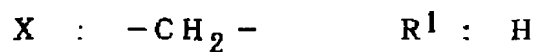
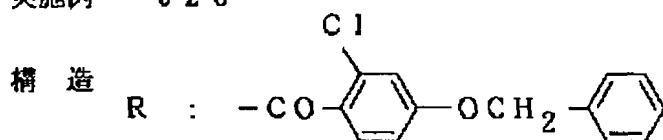
【1071】

{1071}

【表 366】

{Table 36 6 }

実施例 628



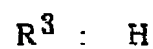
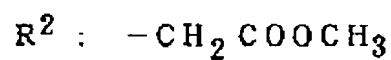
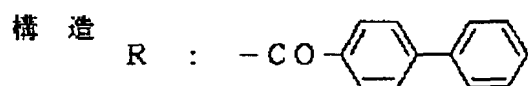
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 178-179℃

形態 : 遊離

実施例 629



結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

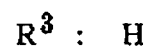
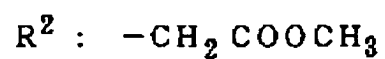
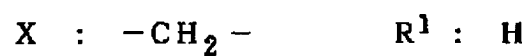
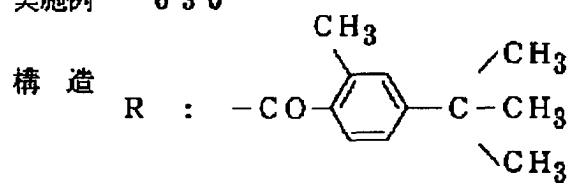
【1072】

{1072}

【表 367】

{Table 36 7 }

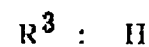
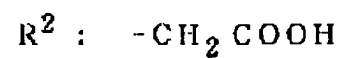
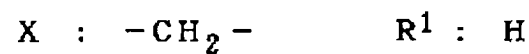
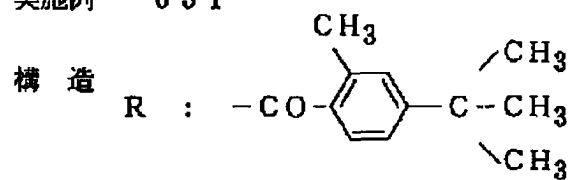
実施例 630



結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

実施例 631



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

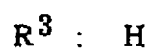
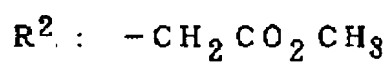
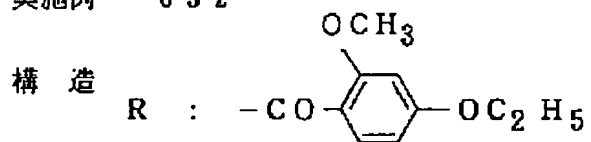
【1073】

{1073}

【表 368】

{Table 36 8 }

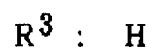
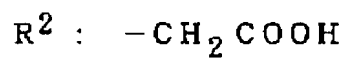
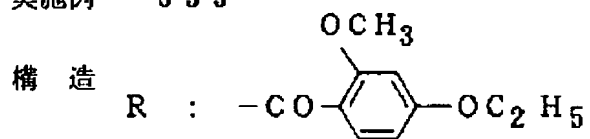
実施例 632



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 633



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

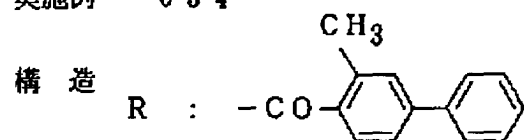
【1074】

{1074}

【表 369】

{Table 36 9 }

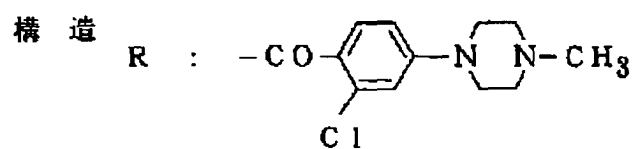
実施例 634

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-FR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 635

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 138-140℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

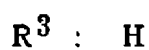
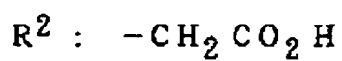
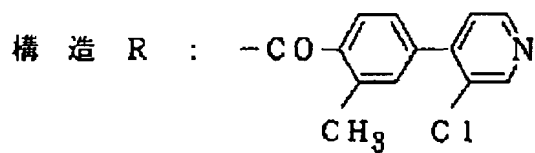
【1075】

{1075}

【表 370】

{Table 37 0 }

実施例 636



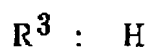
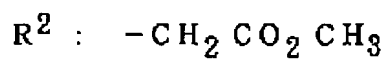
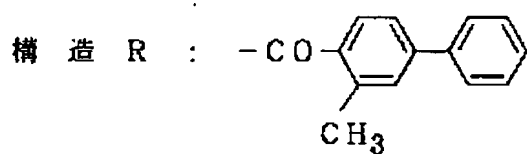
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 208-211℃

形態 : 遊離

実施例 637



結晶形 : 淡褐色油状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

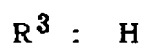
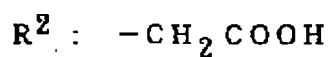
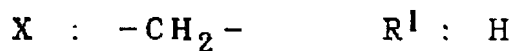
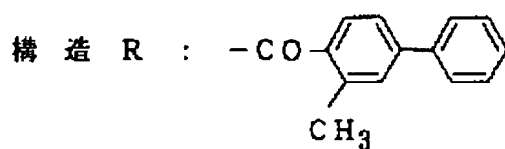
【1076】

{1076}

【表 371】

{Table 37 1 }

実施例 638



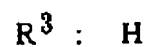
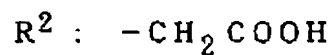
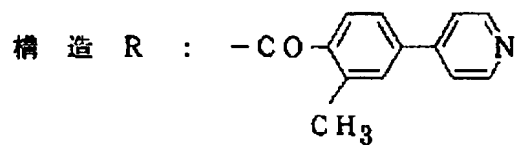
結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : $192-194^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 639



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : $238-239^\circ\text{C}$

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1077】

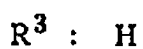
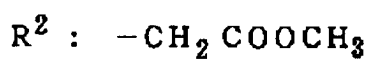
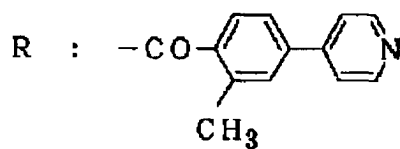
{1077}

【表 372】

{Table 37 2 }

実施例 640

構造

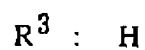
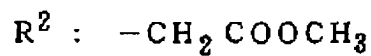
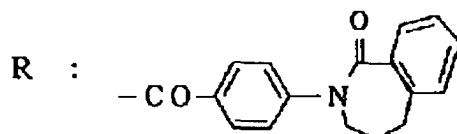


結晶形 : 淡黄色固体

形態 : 遊離

実施例 641

構造



結晶形 : 白色粉末状

融点 : 82 ~ 87°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

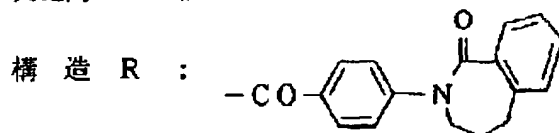
【1078】

{1078}

【表 373】

{Table 37 3 }

実施例 642



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

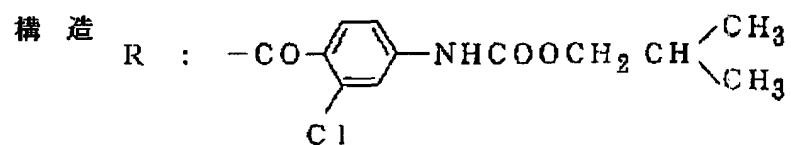
R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : $121-127^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 643



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1079】

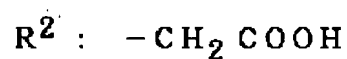
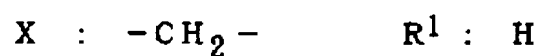
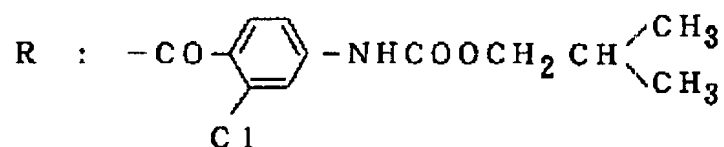
{1079}

【表 374】

{Table 37 4 }

実施例 644

構造

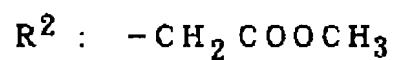
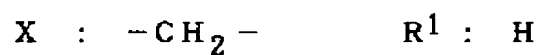
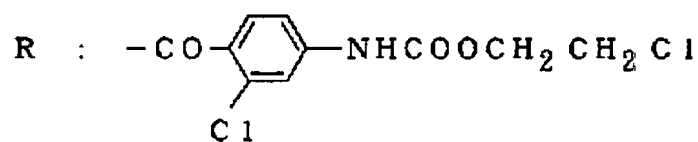


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 645

構造



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1080】

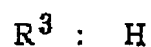
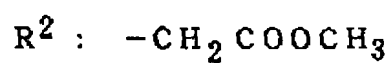
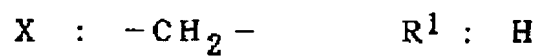
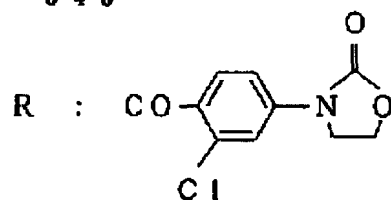
{1080}

【表 375】

{Table 37 5 }

実施例 646

構造

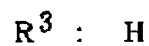
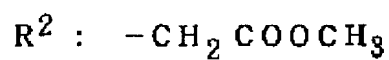
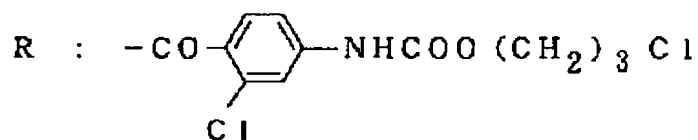


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 647

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1081】

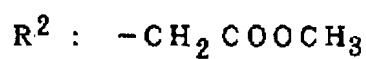
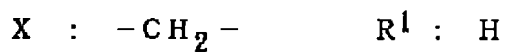
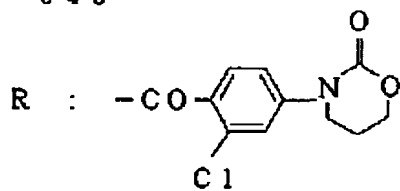
{1081}

【表 376】

{Table 37 6 }

実施例 648

構造

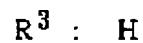
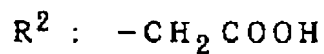
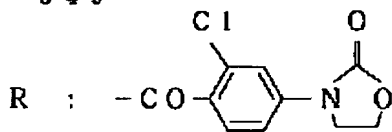


結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

実施例 649

構造



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1082】

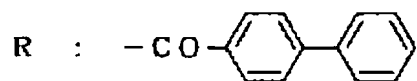
{1082}

【表 377】

{Table 37 7 }

実施例 650

構造



X : 単結合

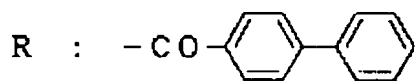
 $R^1 : 6-Cl$ R^2 及び $R^3 : =O$

結晶形 : 微黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 651

構造



X : 単結合

 $R^1 : 6-Cl$ R^2 及び $R^3 : =CH-CO_2C_2H_5$

結晶形 : 微黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1083】

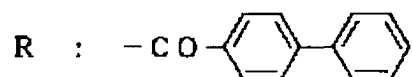
{1083}

【表 378】

{Table 37 8 }

実施例 652

構造



X : 単結合

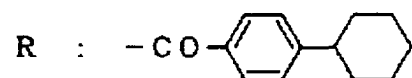
 $R^1 : 6-Cl$ $R^2 : -CH_2CO_2C_2H_5$ $R^3 : H$

結晶形 : 微黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 653

構造



X : 単結合

 $R^1 : 6-Cl$ $R^2 \text{ 及び } R^3 : =O$

結晶形 : 黄色固体

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1084】

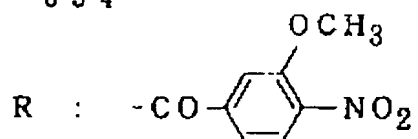
{1084}

【表 379】

{Table 37 9 }

実施例 654

構造



X : 単結合

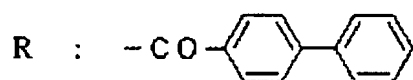
 $R^1 : 6-Cl$ $R^2 \text{ 及び } R^3 : =O$

結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 655

構造



X : 単結合

 $R^1 : 6-Cl$ $R^2 : -CH_2CO_2H$ $R^3 : H$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1085】

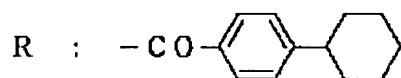
{1085}

【表 380】

{Table 3 80 }

実施例 656

構造



X : 単結合

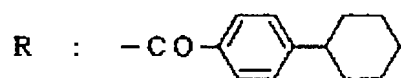
 $R^1 : 6-Cl$ $R^2 \text{ 及び } R^3 : =CH-COOC_2H_5$

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 657

構造



X : 単結合

 $R^1 : 6-Cl$ $R^2 : -CH_2COOH$ $R^3 : H$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

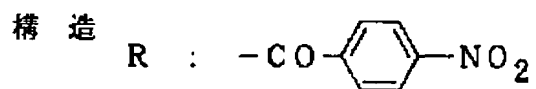
【1086】

{1086}

【表 381】

{Table 3 81 }

実施例 658



X : 単結合 R¹ : 6-Cl

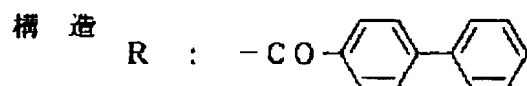
R² : -CH₂CO₂CH₃

R³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 659



X : 単結合 R¹ : 6-Cl

R² : -CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

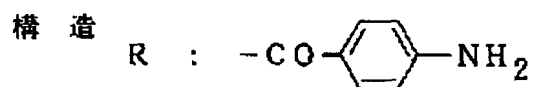
【1087】

{1087}

【表 382】

{Table 3 82 }

実施例 660



X : 単結合 R¹ : 6-Cl

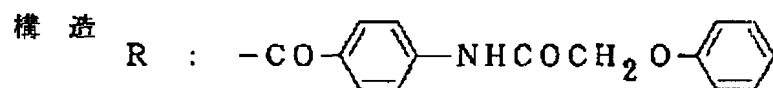
R² : -CH₂CO₂CH₃

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 661



X : 単結合 R¹ : 6-Cl

R² : -CH₂CO₂CH₃

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1088】

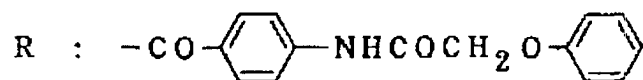
{1088}

【表 383】

{Table 3 83 }

実施例 662

構造



X : 単結合

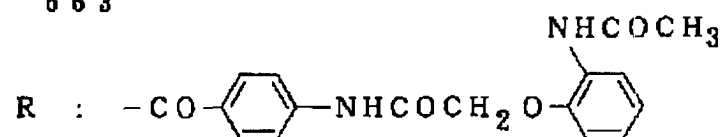
 $R^1 : 6-Cl$ $R^2 : -CH_2COOH$ $R^3 : H$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 663

構造



X : 単結合

 $R^1 : 6-Cl$ $R^2 : -CH_2CO_2CH_3$ $R^3 : H$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

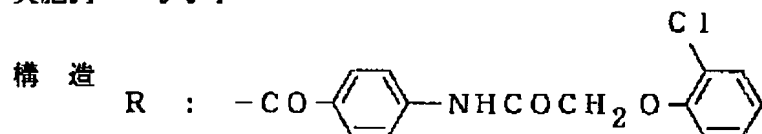
【1089】

{1089}

【表 384】

{Table 3 84 }

実施例 664



X : 単結合 R^1 : 6-Cl

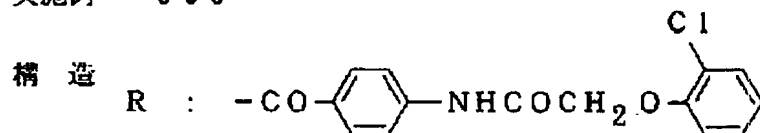
R^2 : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R^3 : H

結晶形 : 赤色不定形

形態 : 遊離

実施例 665



X : 単結合 R^1 : 6-Cl

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1090】

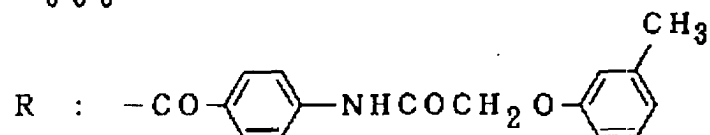
{1090}

【表 385】

{Table 3 85 }

実施例 666

構造



X : 単結合

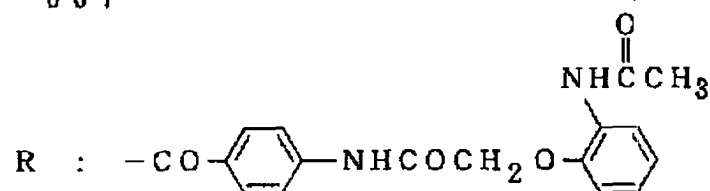
 $R^1 : 6-\text{Cl}$ $R^2 : -\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ $R^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 667

構造



X : 単結合

 $R^1 : 6-\text{Cl}$ $R^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$ $R^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1091】

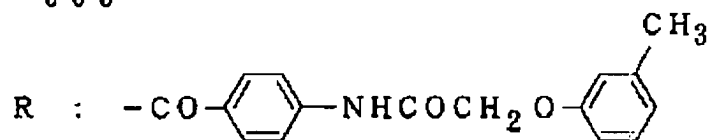
{1091}

【表 386】

{Table 3 86 }

実施例 668

構造



X : 単結合

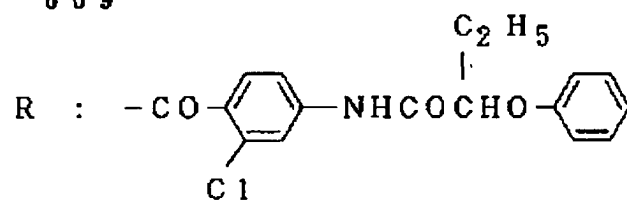
 $R^1 : 6-\text{Cl}$ $R^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$ $R^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 669

構造

X : $-\text{CH}_2-$ $R^1 : \text{H}$ $R^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$ $R^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1092】

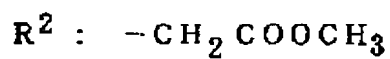
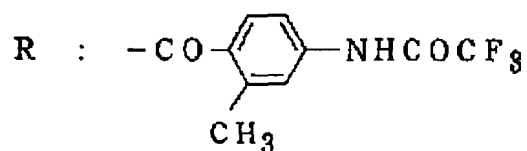
{1092}

【表 387】

{Table 3 87 }

実施例 670

構造

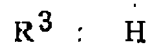
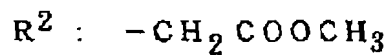
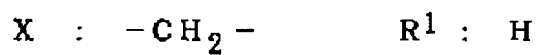
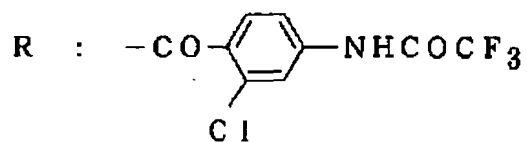


結晶形 : 微赤色粉末状

形態 : 遊離

実施例 671

構造



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1093】

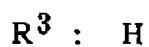
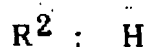
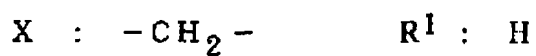
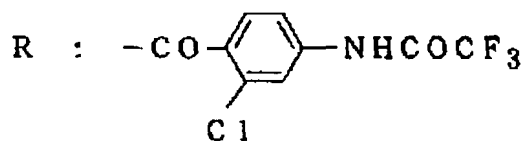
{1093}

【表 388】

{Table 3 88 }

実施例 672

構造

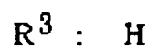
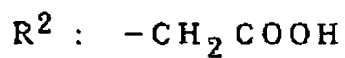
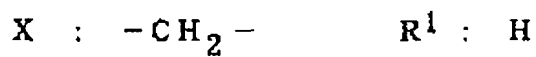
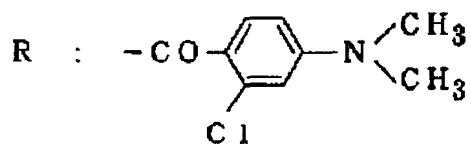


結晶形 : 微赤色粉末状

形態 : 遊離

実施例 673

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

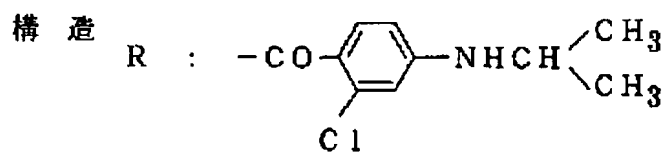
【1094】

{1094}

【表 389】

{Table 3 89 }

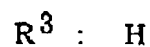
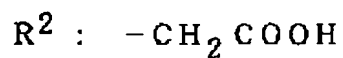
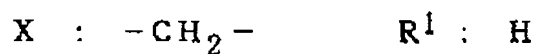
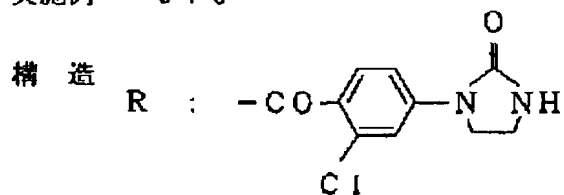
実施例 674



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 675



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1095】

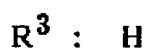
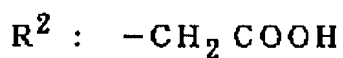
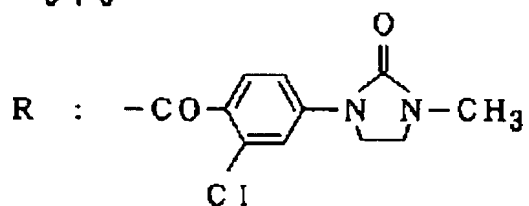
{1095}

【表 390】

{Table 3 90 }

実施例 676

構造

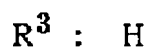
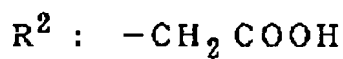
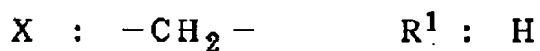
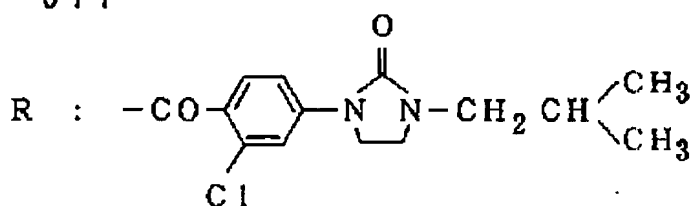


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 677

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1096】

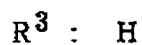
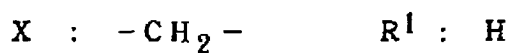
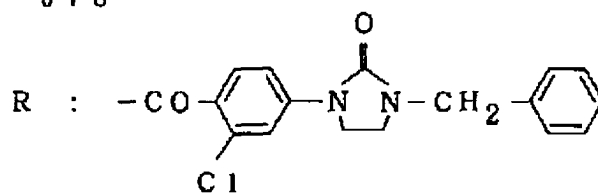
{1096}

【表 391】

{Table 3 91 }

実施例 678

構造

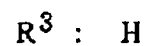
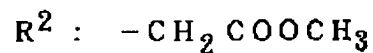
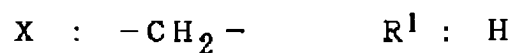
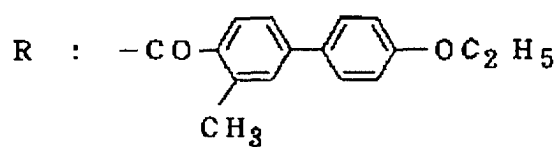


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 679

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1097】

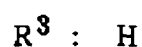
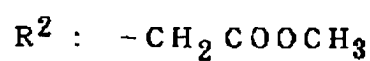
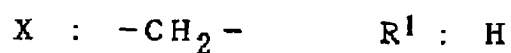
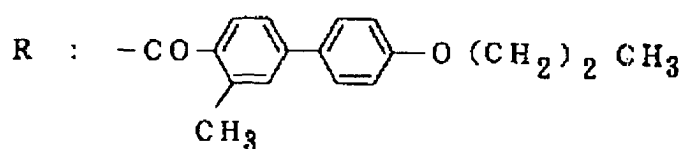
{1097}

【表 392】

{Table 3 92 }

実施例 680

構造

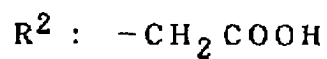
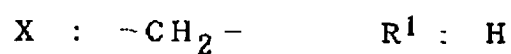
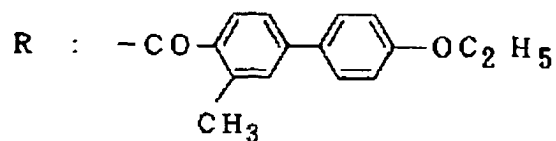


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 681

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 183-183.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

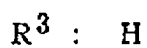
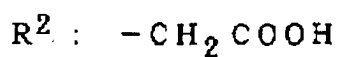
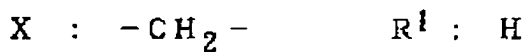
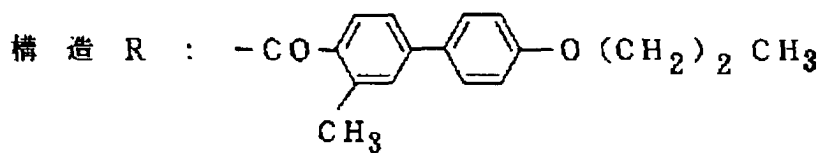
【1098】

{1098}

【表 393】

{Table 3 93 }

実施例 682



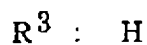
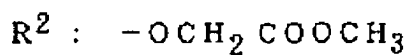
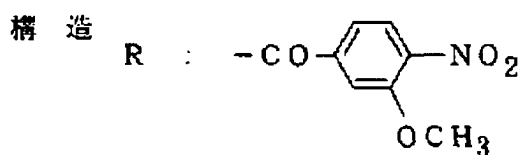
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : $169.5 - 170^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 683



結晶形 : 微黄色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1099】

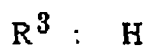
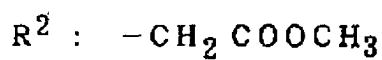
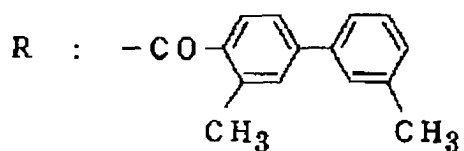
{1099}

【表 394】

{Table 3 94 }

実施例 684

構造

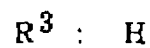
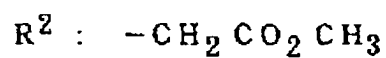
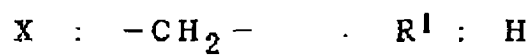
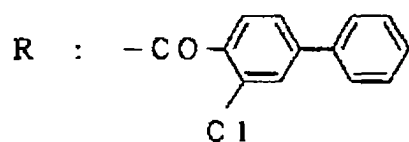


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 685

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1100】

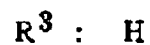
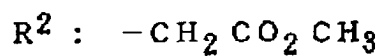
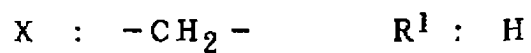
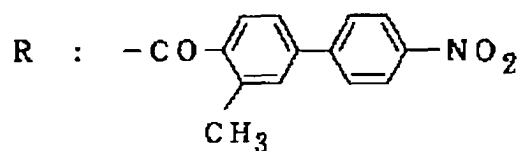
{1100}

【表 395】

{Table 3 95 }

実施例 686

構造

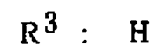
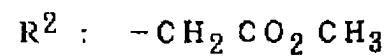
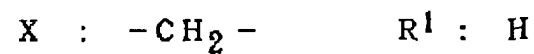
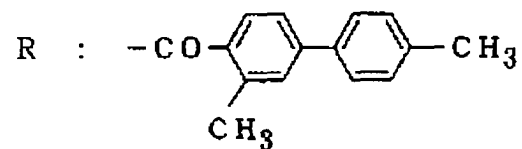


結晶形 : 微黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 687

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

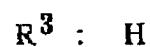
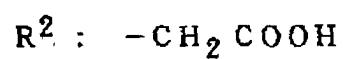
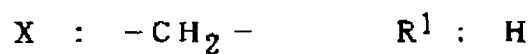
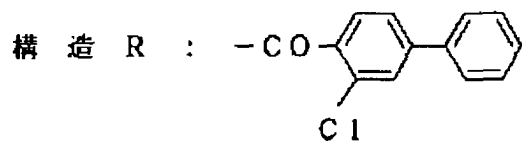
【1101】

{1101}

【表 396】

{Table 3 96 }

実施例 688



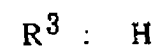
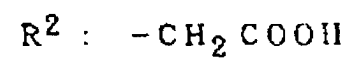
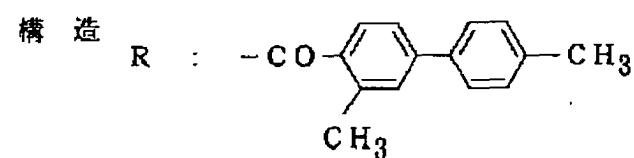
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : $176-177^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 689



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1102】

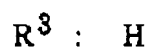
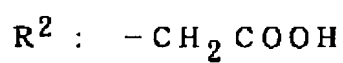
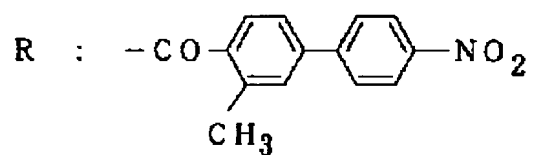
{1102}

【表 397】

{Table 3 97 }

実施例 690

構造

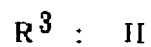
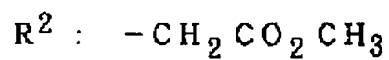
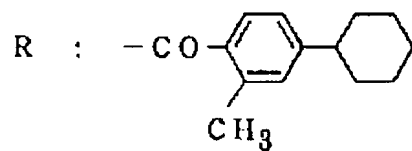


結晶形 : 微黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 691

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1103】

適当な出発原料を用い、実施例 1 及び 2 と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【1104】

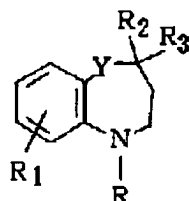
【表 398】

{1103}

compound which is stated in below-mentioned chart making use of suitable starting material, to similar to Working Example 1 and 2 was acquired.

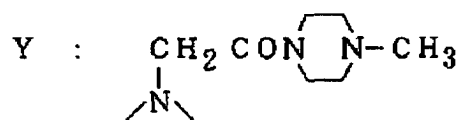
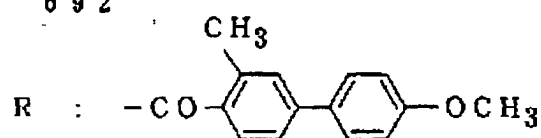
{1104}

{Table 3 98 }



実施例 692

構造

R¹ : HR² 及び R³ : =O

結 晶 形 : 無色不定形

形 態 : 遊 離

【1105】

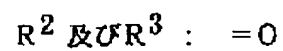
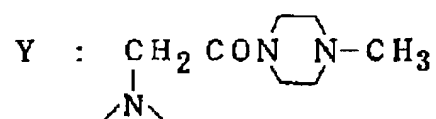
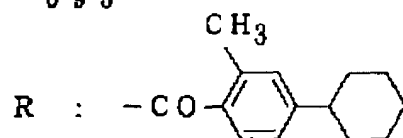
【表 399】

{1105}

{Table 3 99 }

実施例 693

構造

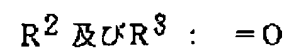
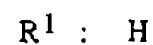
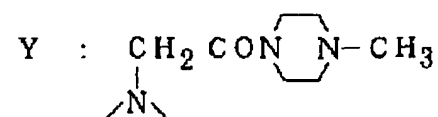
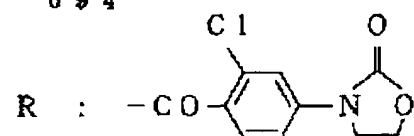


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 694

構造



結晶形 : 白色粉末状

融点 : 166-170℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

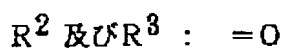
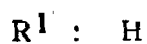
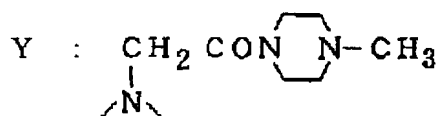
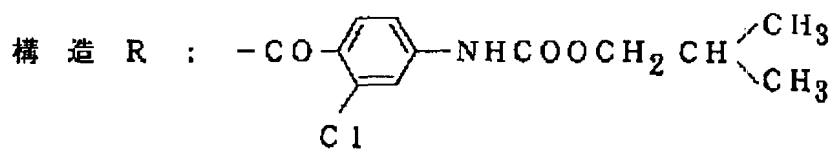
【1106】

{1106}

【表 400】

{Table 4 00 }

実施例 695



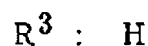
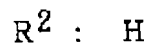
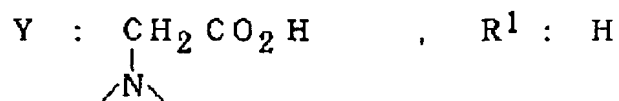
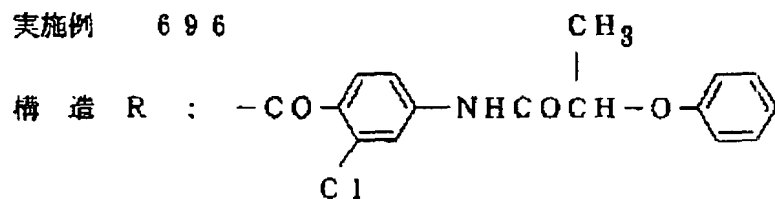
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 215 - 218℃ (分解)

形態 : 遊離

実施例 696



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 182 - 188℃ (分解)

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

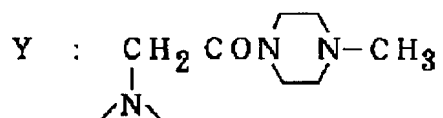
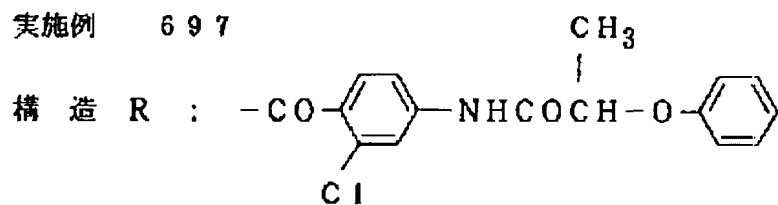
【1107】

{1107}

【表 401】

{Table 4 01 }

実施例 697



R¹ : H

R² : H

R³ : H

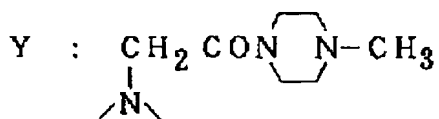
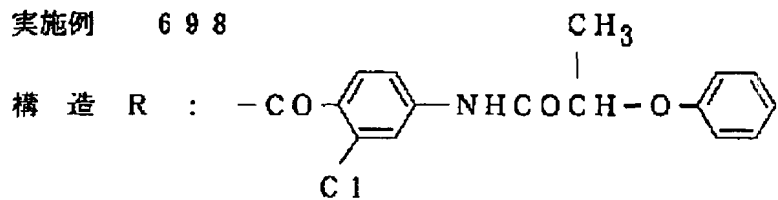
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 105-108℃

形態 : 遊離

実施例 698



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 154-158℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

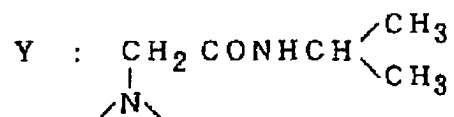
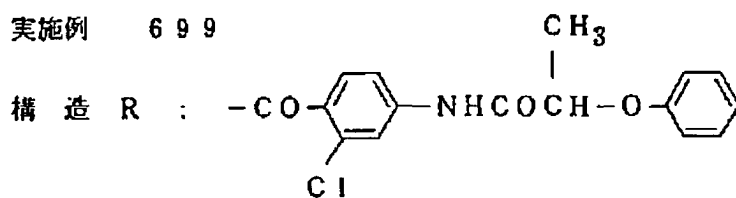
【1108】

{1108}

【表 402】

{Table 4 02 }

実施例 699

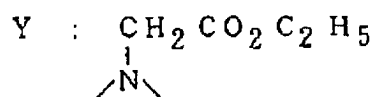
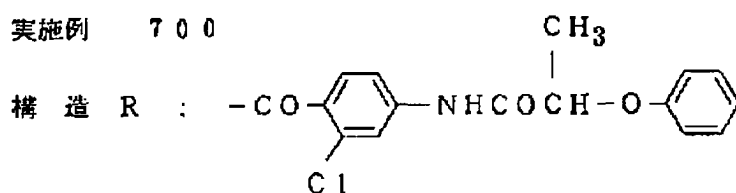
R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 144-145℃

実施例 700

R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1109】

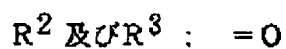
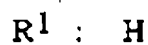
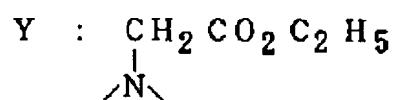
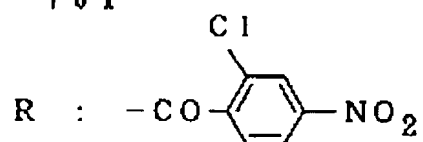
{1109}

【表 403】

{Table 4 03 }

実施例 701

構造

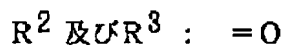
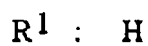
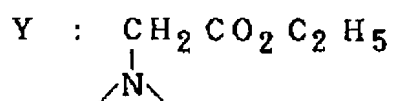
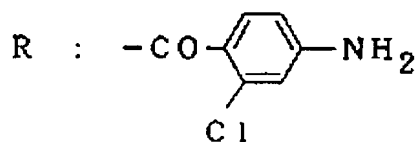


結晶形 : 褐色粉末状

形態 : 遊離

実施例 702

構造



結晶形 : 無色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

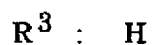
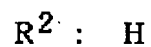
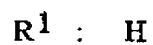
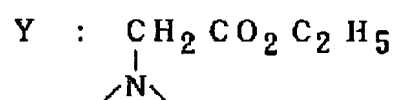
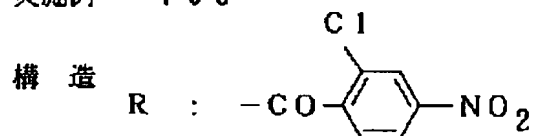
【1110】

{1110}

【表 404】

{Table 4 04 }

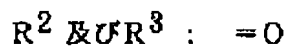
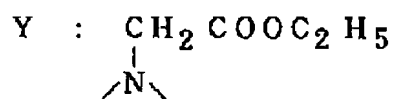
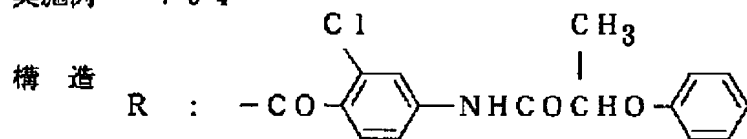
実施例 703



結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

実施例 704



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

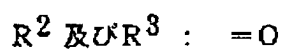
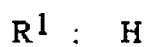
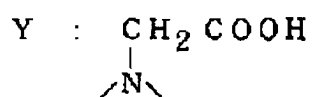
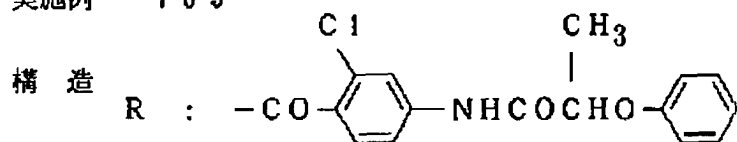
【1111】

{1111}

【表 405】

{Table 4 05 }

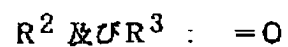
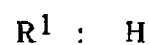
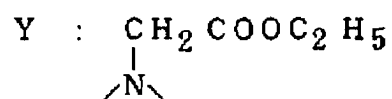
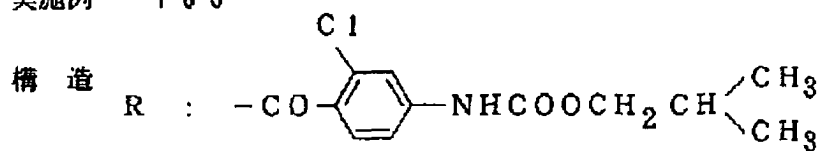
実施例 705



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 706



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

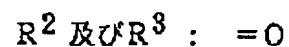
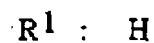
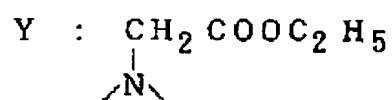
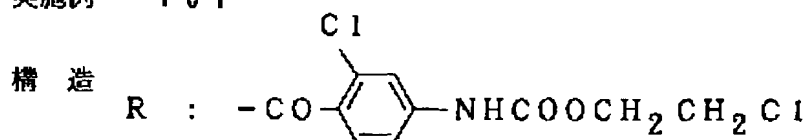
【1112】

{1112}

【表 406】

{Table 4 06 }

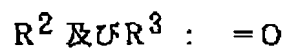
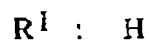
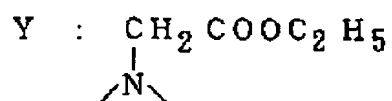
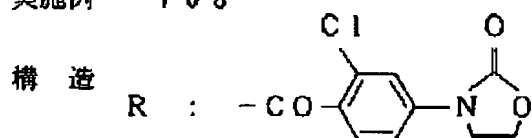
実施例 707



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 708



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

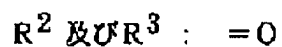
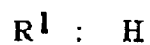
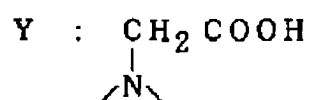
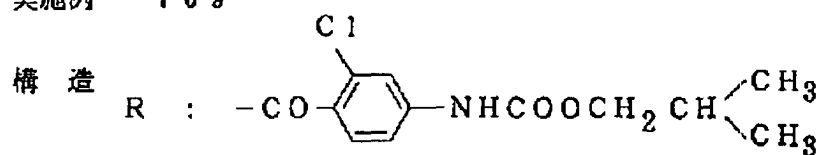
【1113】

{1113}

【表 407】

{Table 4 07 }

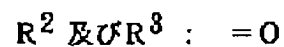
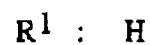
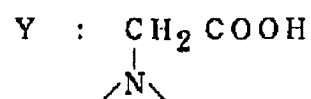
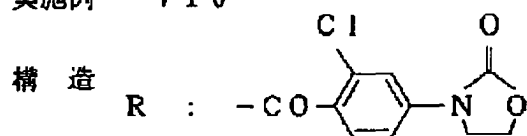
実施例 709



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 710



結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1114】

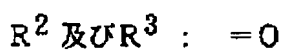
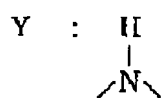
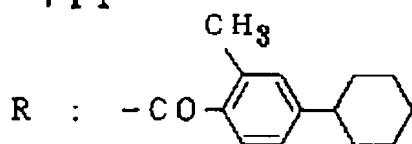
{1114}

【表 408】

{Table 4 08 }

実施例 711

構造

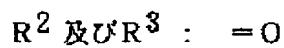
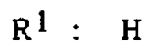
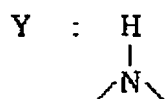
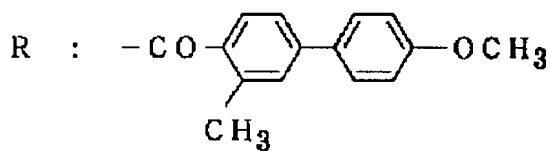


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 712

構造



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1115】

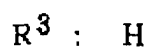
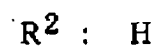
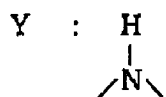
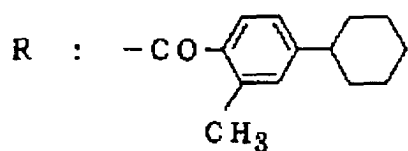
{1115}

【表 409】

{Table 4 09 }

実施例 713

構造

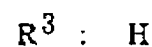
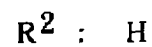
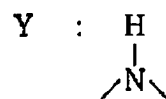
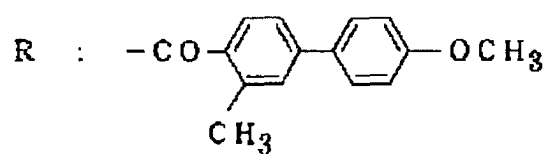


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 714

構造



結晶形 : 無色プリズム状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1116】

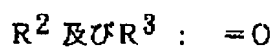
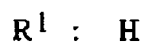
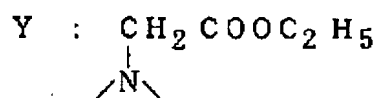
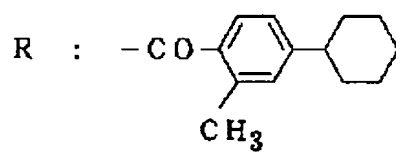
{1116}

【表 410】

{Table 4 10 }

実施例 715

構造

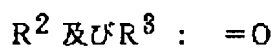
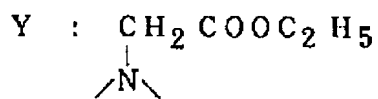
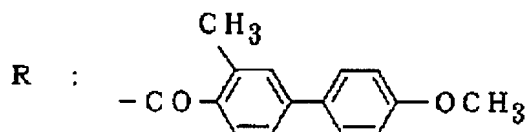


結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 716

構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

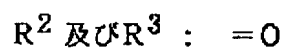
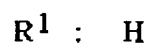
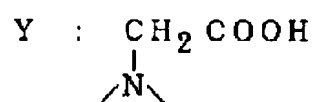
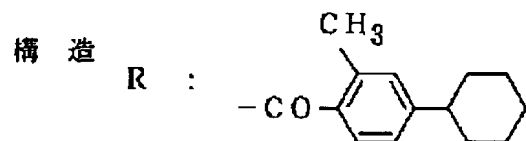
【1117】

{1117}

【表 411】

{Table 4 11 }

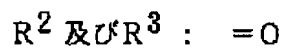
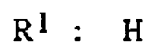
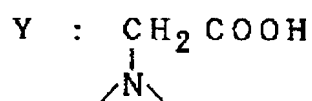
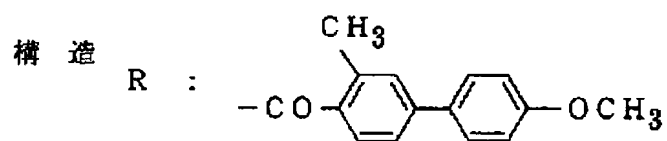
実施例 717



結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 718



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

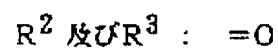
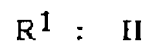
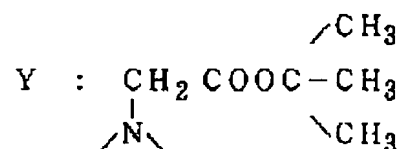
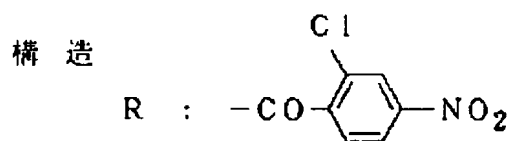
【1118】

{1118}

【表 412】

{Table 4 12 }

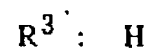
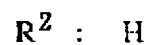
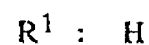
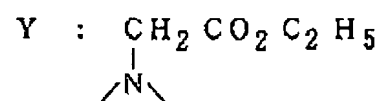
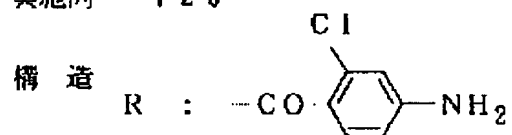
実施例 719



結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 720



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 120-123℃

形態 : 遊離

【1119】

上記で得られる各実施例化合物の NMR スペクトルは、次の通りである。

【1525】

実施例 721

ジメチルスルフィド 170ml に氷冷攪拌下塩化アルミニウム 23.6g を徐々に添加し、続いて 5-メトキシカルボニルメチル-1-[4-(2-フェノキシアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 16.76g のジクロロメタン 150ml 溶液を滴下し、その後室温で 2 時間攪拌した。

反応混合物を濃塩酸-碎氷上に注ぎ込み、ジクロロメタン抽出を行なった。

有機層を水洗後、硫酸マグネシウム乾燥、溶媒を濃縮した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:ジクロロメタン:メタノール=30:1)にて精製して、13.67g の 5-カルボキシメチル-1-[4-(2-フェノキシアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【1526】

白色粉末状、

mp102~106 deg C。

【1527】

実施例 722

7-クロロ-1-[2-メチル-4-(2-アセチルアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.48g をテトラヒドロフラン 7ml に溶解し、これに 5N-水酸化ナトリウム水溶液 0.5ml を加え、室温で 2 時間攪拌した。

反応液を 2N 塩酸により中和し、酢酸エチルにて抽出を行い、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過、濃縮した。

得られた残渣に n-ヘキサン-酢酸エチル(1:1)を加え、洗浄、濾過し、得られた粉末を乾燥して、0.38g の 7-クロロ-1-[2-メチル-4-(2-ヒドロキシアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【1528】

白色粉末状、

mp194~195 deg C

実施例 723

{1119}

nmr spectrum of each Working Example compound which is acquired with description above seems following way.

{1525}

Working Example 721

Under ice cooling agitating it added aluminum chloride 23.6g gradually in dimethyl sulfide 170ml, continuously 5-methoxycarbonyl methyl-1-{4-(2-phenoxycarbonyl amino) benzoyl} - 2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 16.76g dripped dichloromethane 150ml solution, after that 2 hours agitated with room temperature.

It poured reaction mixture on concentrated hydrochloric acid - * ice, extracted dichloromethane.

organic layer after water wash, magnesium sulfate drying, solvent was concentrated.

Refining residue which it acquires with silica gel column chromatography (eluate; dichloromethane: methanol = 30:1), 13.67 g 5-carboxymethyl-1-{4-(2-phenoxycarbonyl amino) benzoyl} - it acquired 2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine.

{1526}

white powder,

mp102~106deg C.

{1527}

Working Example 722

7-chloro-1-{2-methyl-4-(2-acetyl amino) benzoyl} - it melted 2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine 0.48g in tetrahydrofuran 7ml, to this 2 hours it agitated with room temperature including 5 N- sodium hydroxide water solution 0.5ml.

It neutralized reaction mixture with 2 N hydrochloric acid, extracted with ethylacetate, after drying, it filtered and concentrated with magnesium sulfate.

In residue which it acquires you washed, filtered including the n-hexane-ethylacetate (1:1), drying powder which is acquired, 0.38 g 7-chloro-1-{2-methyl-4-(2-hydroxy acetyl amino) benzoyl} - you acquired 2, 3, 4 and 5-tetrahydro-1H-benzo azepine.

{1528}

white powder,

mp194~195deg C

Working Example 723

1-[2-メチル-4-(2-クロロアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.8g をジメチルホルムアミド 5ml に溶解し、これに炭酸カリウム 0.47g、沃化ナトリウム 0.51g 及び 5,6,7,8-テトラヒドロ-1-ナフトール 0.40g を加え、60 deg C で 3 時間攪拌した。

反応液に酢酸エチルを加え、飽和硫酸水素カリウム精製水、飽和食塩水で洗浄後硫酸マグネシウム乾燥後、濾過、濃縮した。

得られた残渣を、1 日放置し、ジクロロメタンにて洗浄し、濾過して粉末を乾燥して、1-{2-メチル-4-[2-(5-テトラヒドロナフチルオキシ)アセチルアミノ]ベンゾイル}-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.72g を得る。

【1529】

白色粉末状、

mp230-232 deg C(分解)

適当な出発原料を用い、実施例 723 と同様にし、前記実施例 55~58、147、148、150~156、158~162、165~166、160、170、176~179、186~196、198、200~207、212、213、215、217、222~224、228~232、338~346、355~358、363、399~402、445~448、583、593、598、661~669、696~700 及び 704~705 の化合物を得た。

【1530】

実施例 724

1-(4-アミノ-2-クロロベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 1g、トリホスゲン 0.3g 及び o-ジクロロベンゼン 10ml の混合物を 130~140 deg C で 4 時間加熱攪拌した。

トリエチルアミン 0.8ml を加え、更に 0.5 時間攪拌し、再びトリエチルアミンを 0.8ml 追加し、更に 0.5 時間攪拌した。

1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン 0.38ml を加え、80 deg C にて 1 時間加熱攪拌した。

ジクロロメタンにて希釈し、水、飽和食塩水洗浄後、硫酸マグネシウム上で乾燥した後、濾過、溶媒留去し、2.9g のオイルを得た。

これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:酢酸エチル-n-ヘキサン=1:1)で精製し、0.47g の 1-[4-(2-テトラヒドロイソキノリルカルボニルアミノ)-2-クロロベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【1531】

1 - { 2 -methyl -4- (2 -chloroacetyl amino) benzoyl } - It melted 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.8g in dimethylformamide 5ml , to this 3 hours it agitated with 60 deg C including potassium carbonate 0.47g, sodium iodide 0.51g and 5, 6, 7 and 8 -tetrahydro -1- naphthol 0.40g.

In reaction mixture with saturated potassium hydrogen sulfate purified water , saturated saline after washing after magnesium sulfate drying , it filtered and concentrated including ethylacetate .

1 day leaving residue which it acquires, washing with dichloromethane ,filtering and drying powder , 1 - {2 -methyl -4- { 2 - (5 -tetrahydro naphthyloxy) acetylamino } benzoyl } - you obtain 2, 3, 4 and 5-tetrahydro -1H-benzo azepine 0.72g.

{1529}

white powder ,

mp230-232deg C (Disassembly)

Aforementioned Working Example 55~58, 147, 148, 150~156, 158~162, 165~166, 160, 170, 176~179, 186~196, 198, 200~207, 212, 213, 215, 217, 222~224, 228~232, 338~346, 355~358, 363, 399~402, 445~448, 583, 593, 598, 661~669, 696~700 and compound 704 - 705 was acquired making use of suitable starting material , to similar to Working Example 723.

{1530}

Working Example 724

1 - (4 -amino -2- chlorobenzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 1g, tri phosgene 0.3g and mixture of o-dichlorobenzene 10ml 4 hours heating and stirring was done with 130 - 140 deg C.

Including triethylamine 0.8ml , furthermore 0.5 hours it agitated, 0.8 ml added triethylamine again, furthermore 0.5 hours agitated.

Including 1, 2, 3 and 4 -tetrahydroisoquinoline 0.38ml , 1 hour heating and stirring it did with 80 deg C.

It diluted with dichloromethane , after drying after water and saturated saline washing and on magnesium sulfate , filtration and solvent removal it did, acquired oil of 2.9 g.

This was refined with silica gel column chromatography (eluate ;ethylacetate -n- hexane =1:1) , 0.47 g 1 - {4 - (2 -tetrahydroisoquinolyl carbonyl amino) - 2 -chlorobenzoyl } - 2, 3, 4 and 5-tetrahydro -1H-benzo azepine were acquired.

{1531}

無色不定形

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.35-2.15,2.70-3.10 及び 4.80-5.00(全 10H,m), 3.66 及び 3.76 (全 2H,各 t,J=5.8Hz), 4.60 及び 4.71(全 2H,各 s), 6.70-7.50(12H,m).

【1532】

実施例 725

1-(4-アミノ-2-クロロベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.8g の o-ジクロロベンゼン 5ml 溶液に、トリホスゲン 0.26g を加え、120 deg C で 3 時間撹拌した。

ここで、トリエチルアミン 0.27g を加え、更に 120 deg C で 2 時間撹拌した。

その後、(4-ピリジル)メタノール 0.29g を加え、120 deg C で 2 時間撹拌した。

反応液に酢酸エチルを加え、水で洗浄後有機層を硫酸マグネシウムで乾燥、濾過し、溶媒を濃縮した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5→ジクロロメタン:メタノール=25:1)にて精製後、残渣をメタノール-ジエチルエーテルで洗浄して 1-{4-[(4-ピリジル)メトキシカルボニルアミノ]-2-クロロベンゾイル}-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.45g を得た。

【1533】

白色粉末状、

mp181-184 deg C。

【1534】

実施例 726

クロロホルム 5ml にトリホスゲン 0.72g を加え、氷冷撹拌下、2-フェノキシエタノール 1.0g を内温が 10 deg C 以下になるようにして加え、0 deg C で 1 時間撹拌した。

これに氷冷撹拌下、1-(4-アミノ-2-クロロベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 1.9g 及びピペリジン 2.5g のクロロホルム 30ml 溶液を徐々に滴下した。

その後室温にて 3 時間撹拌した。

反応液を、飽和硫酸水素カリウム、精製水、飽和炭酸水素ナトリウムで洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過、溶媒を濃縮した。

colorless amorphous

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃); δ ppm :1.35-2.15, 2.70-3.10 and 4.80 - 5.00 (All 10 H, m), 3.66 and 3.76 (All 2 H, each t, J=5.8Hz), 4.60 and 4.71(All 2 H, each s), 6.70 - 7.50 (12 H, m).

{1532}

Working Example 725

1 - (4 -amino -2- chlorobenzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.8g to o-dichlorobenzene 5ml solution , 3 hours it agitated with 120 deg C including tri phosgene 0.26g.

Here, furthermore 2 hours it agitated with 120 deg C including the triethylamine 0.27g.

After that, 2 hours it agitated with 120 deg C including (4 -pyridyl) methanol 0.29g.

In reaction mixture including ethylacetate , with water after washing with magnesium sulfate it dried, filtered organic layer , concentrated solvent .

residue which it acquires with silica gel column chromatography (eluate ;ethylacetate :n- hexane =1:5*dichloromethane :methanol =25:1) after refining, washing residue with methanol -diethyl ether , 1 - {4 - { (4 -pyridyl) methoxycarbonylamino } - 2 -chlorobenzoyl } - it acquired 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.45g.

{1533}

white powder ,

mp181-184deg C.

{1534}

Working Example 726

In chloroform 5ml under ice cooling agitating, internal temperature becomes including the tri phosgene 0.72g 10 deg C or less, requiring 2 -phenoxy ethanol 1.0g, it added, 1 hour agitated with 0 deg C.

Under ice cooling agitating, 1 - (4 -amino -2- chlorobenzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 1.9g and chloroform 30ml solution of piperidine 2.5g * was dripped gradually in this.

After that 3 hours it agitated with room temperature .

reaction mixture , with saturated potassium hydrogen sulfate , purified water , saturated sodium bicarbonate after washing, was dried with magnesium sulfate , filtration and solvent were concentrated.

残渣をジエチルエーテルから再結晶を行ない、1-[4-(2-フェノキシエトキシカルボニルアミノ)-2-クロロベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン(1.3g)を得た。

【1535】

白色粉末状

mp144~146 deg C.

【1536】

適当な出発原料を用い、実施例 725 及び 726 と同様にして前記実施例 157、167、197、199、214、233、234、406、407、420、538、540、549、550、552、556、557、559、568、587、588、596、604、643、645、647、695、706、707 及び 709 の化合物を得た。

【1537】

実施例 727

5-エトキシカルボニルメチル-1-[4-(2-クロロエトキシカルボニルアミノ)-2-クロロベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-1,5-ベンゾジアゼピン 0.9g、炭酸カリウム 0.40g 及び沃化ナトリウム 0.43g のジメチルホルムアミド 15ml 混合物を 80 deg C で 8 時間攪拌した。

反応液に酢酸エチルを加え、水洗後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過、溶媒を留去した。

得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出液:ジクロロメタン:メタノール=30:1)にて精製を行い、5-エトキシカルボニルメチル-1-[4-(2-オキソテトラヒドロオキサゾール-3-イル)-2-クロロベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-1,5-ベンゾジアゼピン 0.65g を得た。

【1538】

無色不定形

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.34(3H,t,J=7.15Hz), 2.55-3.05,3.70-4.61 及び 4.79-5.08[全 12 H,m,4.29(q,J=7.15Hz,4.46(t,J=7.88Hz)],6.81-7.72(7H,m)。

【1539】

適当な出発原料を用い、実施例 727 と同様にして前記実施例 511、594、646、649、694 及び 710 の化合物を得た。

【1540】

実施例 728

residue recrystallization was done from diethyl ether, 1 - {4 - (2 -phenoxy ethoxy carbonyl amino) - 2 -chlorobenzoyl } - 2, 3, 4 and 5-tetrahydro -1H-benzo azepine (1.3 g) was acquired.

{1535}

white powder

mp144~146deg C.

{1536}

Aforementioned Working Example 157, 167, 197, 199, 214, 233, 234, 406, 407, 420, 538, 540, 549, 550, 552, 556, 557, 559, 568, 587, 588, 596, 604, 643, 645, 647, 695, 706, 707 and compound of 709 were acquired making use of suitable starting material, to similar to Working Example 725 and 726.

{1537}

Working Example 727

5 - [etokishikarubonimechiru] - 1 - {4 - (2 -chloro ethoxy carbonyl amino) - 2 -chlorobenzoyl } - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-1, 5-benzodiazepine 0.9g, potassium carbonate 0.40g and dimethylformamide 15ml mixture of sodium iodide 0.43g 8-hour was agitated with 80 deg C.

In reaction mixture after water wash, organic layer was dried with magnesium sulfate including ethylacetate, filtration and solvent were removed.

residue which it acquires it refined with silica gel chromatography (eluate :dichloromethane :methanol =30:1), 5 -ethoxy carbonyl methyl -1 - {4 - (2 -oxo tetrahydro oxazole -3- yl) - 2 -chlorobenzoyl } - acquired 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-1, 5-benzodiazepine 0.65g.

{1538}

colorless amorphous

q, J=7.15Hz, 4.46 (t, J=7.88Hz), 6.81 - 7.72 (7 H, m). All 12 H, m, 4.29 ¹H-nmr (200 MHz, CDCl₃); δ ppm :1.34 (3 H, t, J=7.15Hz), 2.55 - 3.05 and 3.70 - 4.61 and 4.79 - 5.08

{1539}

Aforementioned Working Example 511, 594, 646, 649, 694 and compound of 710 were acquired making use of suitable starting material, to similar to Working Example 727.

{1540}

Working Example 728

1-[4-(1-ピペラジニル)-2-クロロベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.25g, 37%ホルムアルデヒド 0.45g 及び水素化シアノホウ素ナトリウム 0.12g のメタノール 5ml 混合物に、氷冷撹拌下、酢酸 0.12g を加え、室温で 1 時間撹拌した。

反応液に、酢酸エチルを加え、2N 水酸化ナトリウム、精製水にて洗浄後、有機層を硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=10:1)にて精製し、1-[4-(4-メチル-1-ピペラジニル)-2-クロロベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 0.10g を得た。

【1541】

白色粉末状、

mp138-140 deg C.

【1543】

実施例 729

1-[4-ニトロ-2-クロロベンゾイル]-1,5-ベンゾジアゼピン 5g 及びブromo酢酸エチル 16.7ml をアセトニトリル 100ml に溶解し、1.8-ジアザビスクロ[5.4.0]-7-ウンデセン 11.3ml を徐々に滴下した。

混合物を 2 日間、加熱還流後、濃縮し、水、クロロホルムを加えて抽出し、炭酸ナトリウムにて乾燥シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;n-ヘキサン:酢酸エチル=4:1→1:1)にて精製し、1-(4-ニトロ-2-クロロベンゾイル)-5-エトキシカルボニルメチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-1,5-ベンゾジアゼピン 4.4g を得た。

【1544】

淡黄色油状

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ ppm:1.22-1.43(3H, m), 1.78-2.38(2H,m), 2.99-3.24(2H,m), 3.43-3.66(1H,m), 3.78-4.39(4H,m), 4.65-4.89(1H,m), 6.67(1H,dt,J=7.6,J=1.3Hz), 6.70(1H,dd,J=8.2,J=1.3Hz), 6.89-6.99(1H,m), 7.05(1H,dd,J=7.3,J=1.7Hz), 7.37(1H,d,J=8.4Hz), 7.81(1H,dd,J=8.4,J=2.1Hz), 8.10(1H,d,J=2.1Hz)。

【1545】

適当な出発原料を用い、実施例 729 と同様にして前記実施例 692~702、704~710 及び 715~720 の化合物を得た。

【1546】

実施例 730

1 - {4 - (1 - piperazinyl) - 2 - chlorobenzoyl} - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.25g, 37%formaldehyde 0.45g and to methanol 5ml mixture of sodium cyanoborohydride 0.1 2g, under ice cooling agitating, 1 hour it agitated with room temperature including the acetic acid 0.1 2g.

In reaction mixture , with 2 Nsodium hydroxide , purified water after washing, it dried organic layer with the magnesium sulfate including ethylacetate , after filtering, concentrated and itrefined residue which is acquired with column chromatography (eluate ;dichloromethane :methanol =10:1) , 1 - {4 - (4 -methyl -1- piperazinyl) - 2 -chlorobenzoyl } -acquired 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.1 0g.

{1541}

white powder ,

mp138-140deg C.

{1543}

Working Example 729

1 - {4 -nitro -2- chlorobenzoyl } - 1 and 5 -benzodiazepine 5g and ethyl bromoacetate 16.7ml was melted in acetonitrile 100ml , 1.8-diazabicyclo {5.4 . 0} - 7 -undecene 11.3ml * were dripped gradually.

2 day , heating and refluxing later, it concentrated mixture , it extracted including thewater and chloroform , with sodium carbonate refined with dry silica gel column chromatography (eluate ;n- hexane :ethylacetate =4 : 1 *1:1) , 1 - (4 -nitro -2- chlorobenzoyl) - 5 -ethoxy carbonyl methyl -2, 3, 4, 5- [ratorahidoro] - acquired 1 H-1, 5-benzodiazepine 4.4g.

{1544}

pale yellow oily

¹H-nmr (200 MHz , CDCl₃) ;δ ppm :1.22-1.43 (3 H, m) , 1.78 - 2.38 (2 H, m) , 2.99 - 3.24 (2 H, m) , 3.43 - 3.66 (1 H, m) , 3.78 - 4.39 (4 H, m) , 4.65 - 4.89 (1 H, m) , 6.67 (1 H, dt, J=7.6, J=1.3Hz) , 6.70 (1 H, dd, J=8.2, J=1.3Hz) , 6.89 - 6.99 (1 H, m) , 7.05 (1 H, dd, J=7.3, J=1.7Hz) , 7.37 (1 H, d, J=8.4Hz) , 7.81 (1 H, dd, J=8.4, J=2.1Hz) , 8.10 (1 H, d, J=2.1Hz) .

{1545}

Aforementioned Working Example 692~702, 704~710 and compound 715 - 720 was acquired making use of suitable starting material , to similar to Working Example 729.

{1546}

Working Example 730

JP1997221476A

1997-8-26

5-シアノメチル-1-(4-フェニル-2-クロロベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン 1g、塩化アンモニウム 0.4g 及びナトリウムアジド 0.48g をジメチルホルムアミド 10ml に懸濁し、110~120 deg C で 16 時間加熱した。

更に塩化アンモニウム 0.4g 及びナトリウムアジド 0.48g を追加し、16 時間加熱した。

ジメチルホルムアミドを減圧留去し、1N 塩酸を加えて酸性とし、クロロホルム抽出した。

有機層を水洗し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。

残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製(溶出液:ジクロロメタン→ジクロロメタン:メタノール=20:1)し、得られた油状物にジエチルエーテルを加えて結晶化すると、5-(5-テトラゾリル)メチル-1-(4-フェニル-2-クロロベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンが白色粉末状として 0.9g 得られた。

【1547】

mp191~194 deg C.

【1548】

適当な出発原料を用い、実施例 1 及び 2 と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【1549】

【表 413】

5 -cyanomethyl -1- (4 -phenyl -2- chlorobenzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 1g, ammonium chloride 0.4g and suspension it did sodium azido 0.48g in dimethylformamide 10ml , 16 hours heated with 110 - 120 deg C.

Furthermore it added ammonium chloride 0.4g and sodium azido 0.48g, 16 hours heated.

vacuum distillation it did dimethylformamide , it made acidity including 1 Nhydrochloric acid , the chloroform extraction did.

water wash it did organic layer , after magnesium sulfate drying concentrated.

When refining (eluate ;dichloromethane

*dichloromethane :methanol =20:1) it does residue with silica gel column chromatography , crystallization it does in oil which is acquired including diethyl ether , 5 - (5 -tetrazolyl) methyl -1- (4 -phenyl -2- chlorobenzoyl) - 2, 3, 4 and 5 -tetrahydro -1H-benzo azepine 0.9 g it acquired as white powder .

{1547}

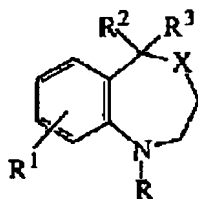
mp191~194deg C.

{1548}

compound which is stated in below-mentioned chart making use of suitable starting material , to similar to Working Example 1 and 2 was acquired.

{1549}

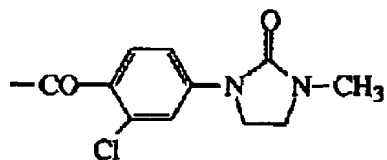
{Table 4 13 }



実施例 731

構造

R :

X : —CH₂—R¹ : HR² :R³ : H

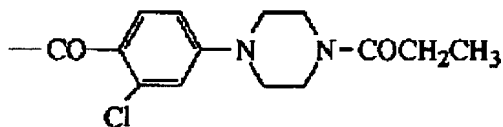
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 732

構造

R :

X : —CH₂—R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 136 - 138℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1550】

{1550}

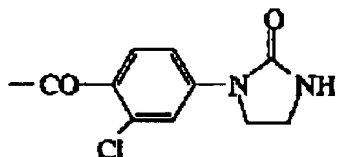
【表 414】

{Table 4 14 }

実施例 733

構造

R :

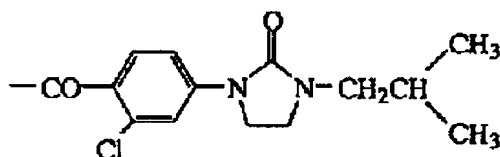
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 734

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1551】

{1551}

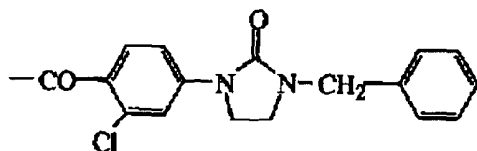
【表 415】

{Table 4 15 }

実施例 735

構造

R :

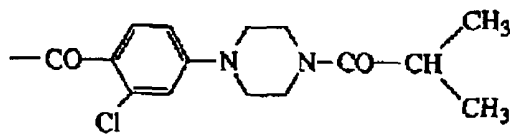
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 736

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【1552】

{1552}

JP1997221476A

1997-8-26

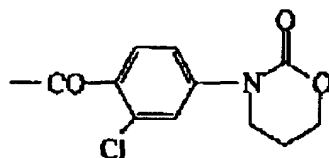
【表 416】

{Table 4 16 }

実施例 737

構造

R :

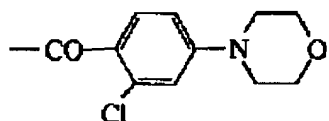
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール洗淨
融点 : 196 - 198℃
形態 : 遊離

実施例 738

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル - n - ヘキサン
融点 : 124 - 126℃
形態 : 遊離

【1553】

{1553}

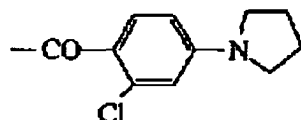
【表 417】

{Table 4 17 }

実施例 739

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール

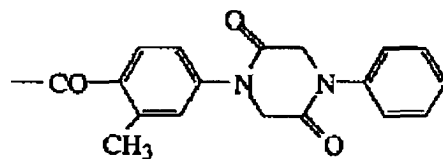
融点 : 160 - 162℃

形態 : 遊離

実施例 740

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1554】

{1554}

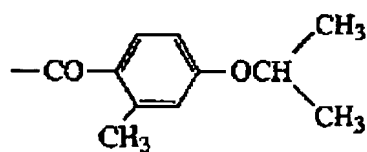
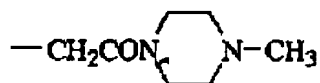
【表 418】

{Table 4 18 }

実施例 741

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² :R³ : H

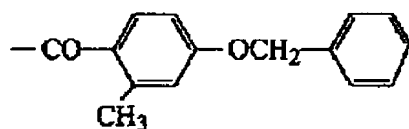
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 742

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1555】

{1555}

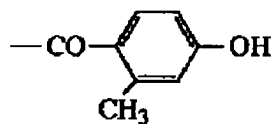
【表 419】

{Table 4 19 }

実施例 743

構造

R :

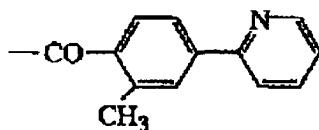
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 744

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル- n-ヘキサン
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1556】

{1556}

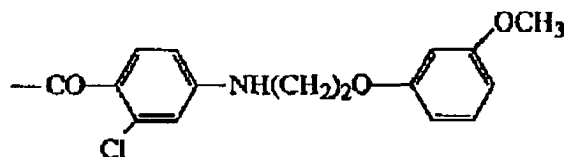
【表 420】

{Table 4 20 }

実施例 745

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

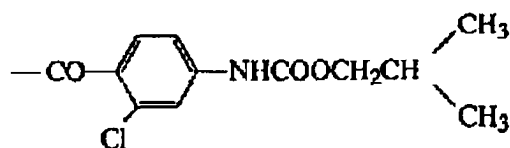
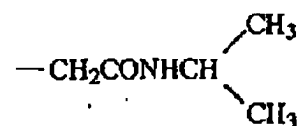
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 746

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン・酢酸エチル

融点 : 162 - 164℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1557】

{1557}

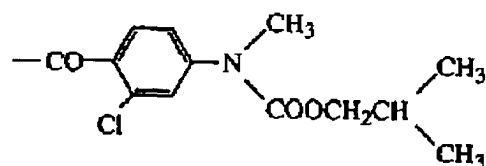
【表 421】

{Table 4 21 }

実施例 747

構造

R :

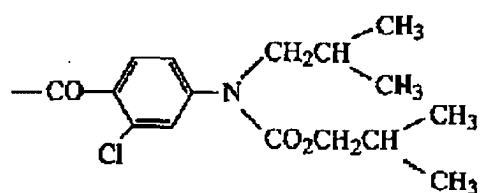
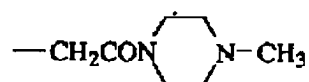
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 748

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1558】

{1558}

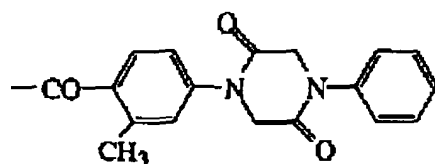
【表 422】

{Table 4 22 }

実施例 749

構造

R :

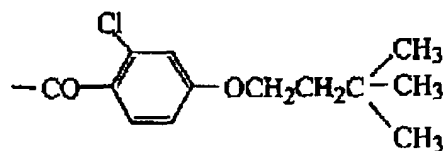
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 750

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 118 - 119℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1559】

{1559}

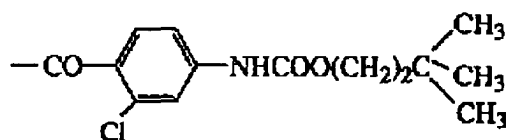
【表 423】

{Table 4 23 }

実施例 751

構造

R :

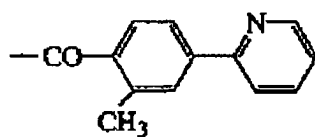
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 752

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1560】

{1560}

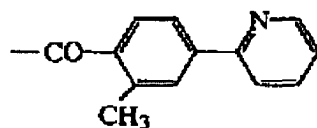
【表 424】

{Table 4 24 }

実施例 753

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² :R³ : H

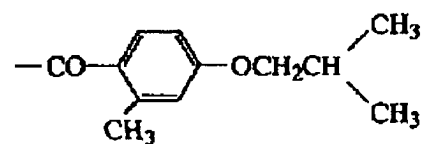
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 754

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1561】

{1561}

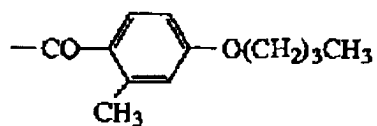
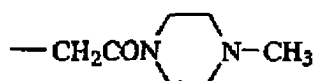
【表 425】

{Table 4 25 }

実施例 755

構造

R :

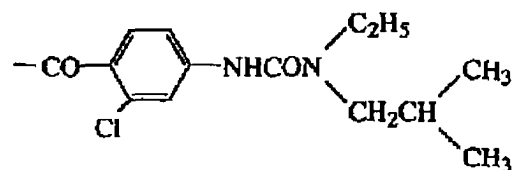
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 756

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 2HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1562】

{1562}

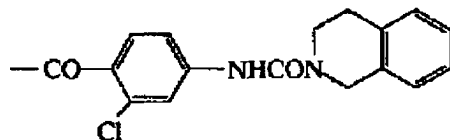
【表 426】

{Table 4 26 }

実施例 757

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

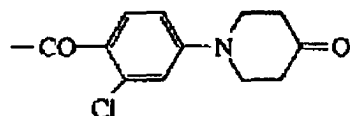
融点 : 201.5 - 204℃

形態 : HCl

実施例 758

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

融点 : 120 - 122℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1563】

{1563}

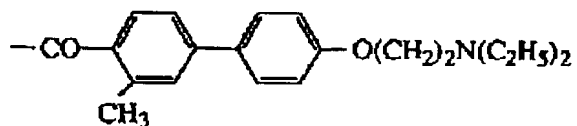
【表 427】

{Table 4 27 }

実施例 759

構造

R :

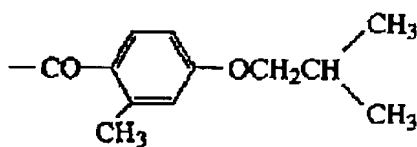
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 760

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1564】

{1564}

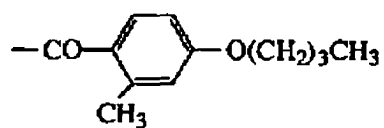
【表 428】

{Table 4 28 }

実施例 761

構造

R :

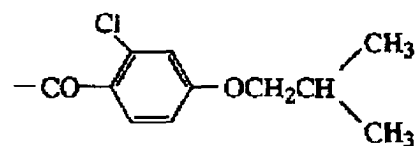
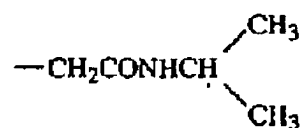
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 762

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 147 - 148℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1565】

{1565}

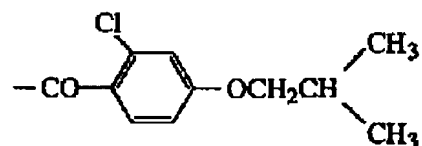
【表 429】

{Table 4 29 }

実施例 763

構造

R :

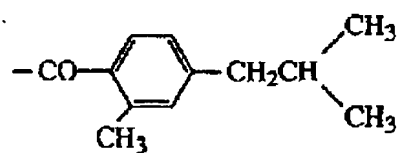
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ ; 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
 融点 : 178 - 179℃
 形態 : 遊離

実施例 764

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
 形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1566】

{1566}

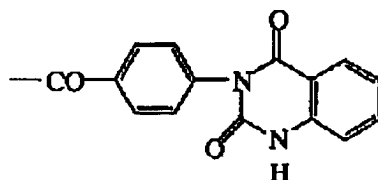
【表 430】

{Table 43 0 }

実施例 765

構造

R :

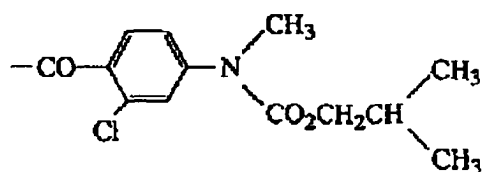
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色鱗片状
 再結晶溶媒 : メタノール-クロロホルム-ジエチルエーテル
 融点 : 300℃以上
 形態 : 遊離

実施例 766

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1567】

{1567}

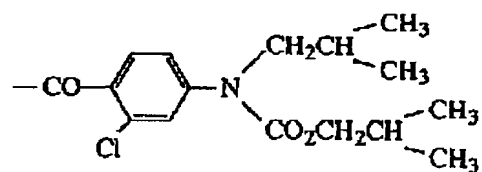
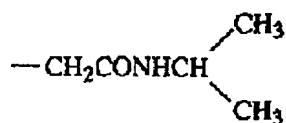
【表 431】

{Table 43 1 }

実施例 767

構造

R :

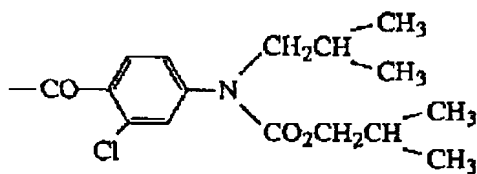
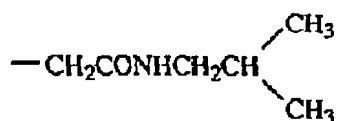
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
 形態 : 遊離

実施例 768

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1568】

{1568}

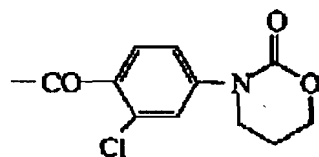
【表 432】

{Table 43 2 }

実施例 769

構造

R :

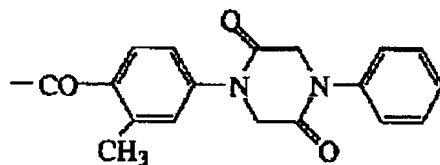
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 770

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1569】

{1569}

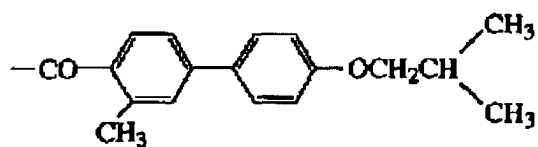
【表 433】

{Table 43 3 }

実施例 771

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

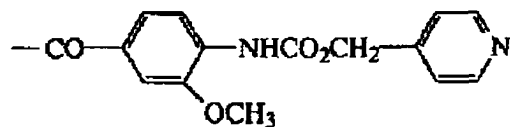
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 772

構造

R :



X : H

R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

融点 : 130 - 133℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1570】

{1570}

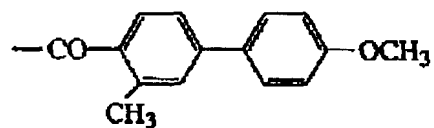
【表 434】

{Table 43 4 }

実施例 773

構造

R :

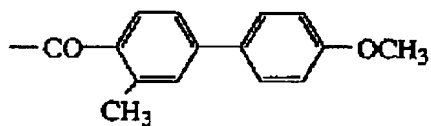
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 774

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1571】

{1571}

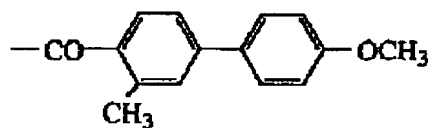
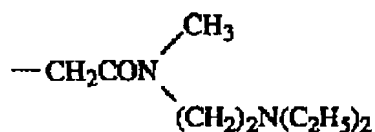
【表 435】

{Table 43 5 }

実施例 775

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

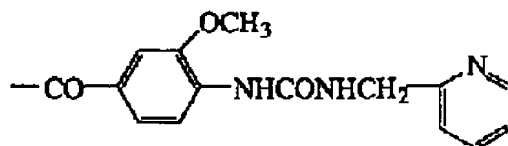
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 776

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 174.5 - 175.5℃

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1572】

{1572}

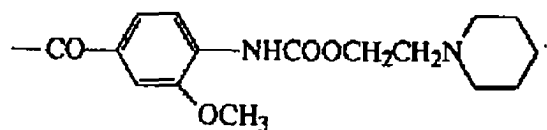
【表 436】

{Table 43 6 }

実施例 777

構造

R :

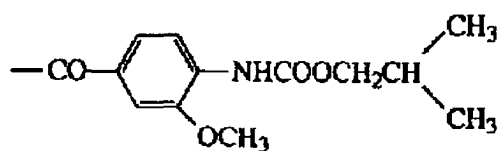
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

実施例 778

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【1573】

{1573}

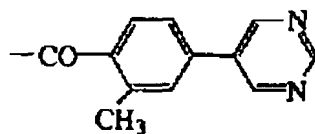
【表 437】

{Table 43 7 }

実施例 779

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

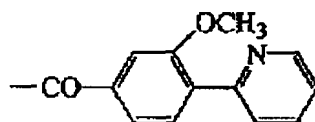
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 780

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

【1574】

{1574}

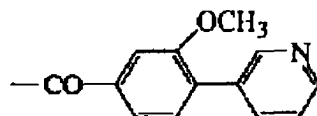
【表 438】

{Table 43 8 }

実施例 781

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

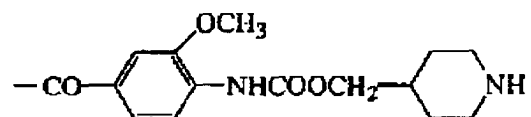
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 782

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

融点 : 123 - 125°C

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1575】

{1575}

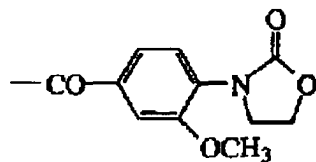
【表 439】

{Table 43 9 }

実施例 783

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

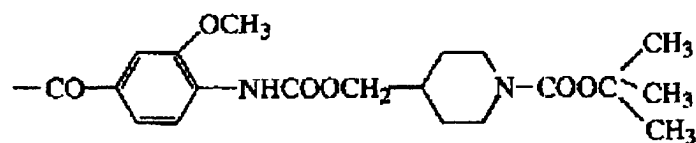
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 784

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1576】

{1576}

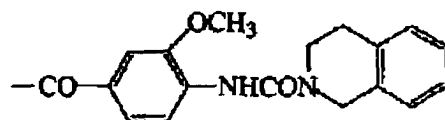
【表 440】

{Table 44 0 }

実施例 785

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

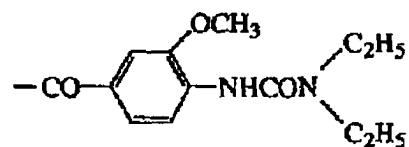
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 786

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1577】

{1577}

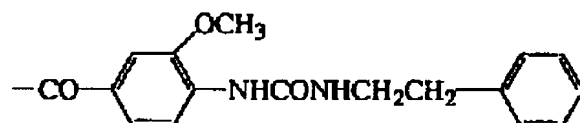
【表 441】

{Table 44 1 }

実施例 787

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

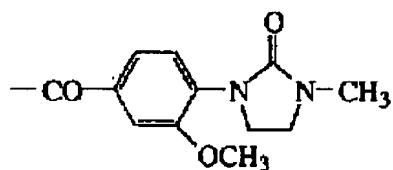
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 788

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1578】

{1578}

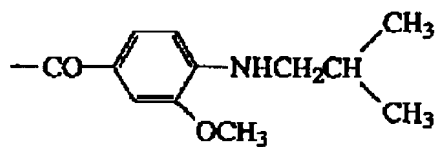
【表 442】

{Table 44 2 }

実施例 789

構造

R :

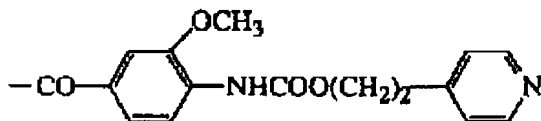
X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 790

構造

R :

X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

【1579】

{1579}

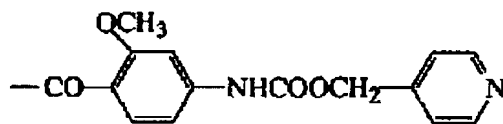
【表 443】

{Table 44 3 }

実施例 791

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

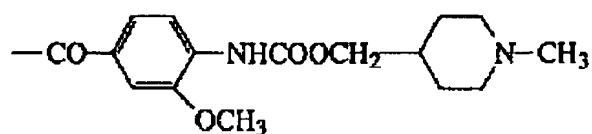
融点 : 135 - 139℃

形態 : 遊離

実施例 792

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1580】

{1580}

JP1997221476A

1997-8-26

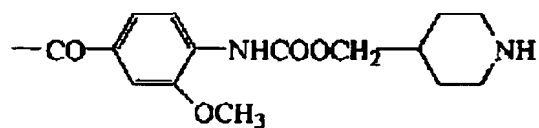
【表 444】

{Table 44 4 }

実施例 793

構造

R :

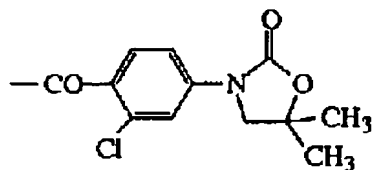
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 白色粉末状
 再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄
 融点 : 123 - 125℃
 形態 : 遊離

実施例 794

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
 形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1581】

{1581}

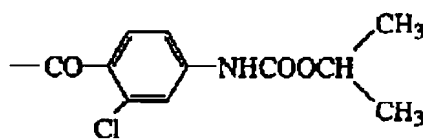
【表 445】

{Table 44 5 }

実施例 795

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

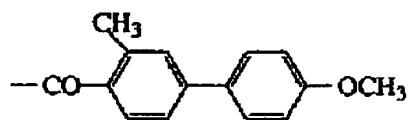
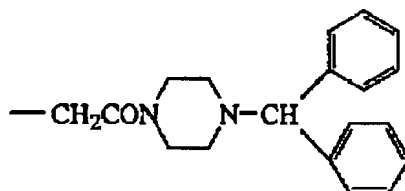
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 796

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1582】

{1582}

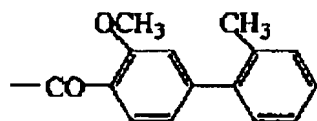
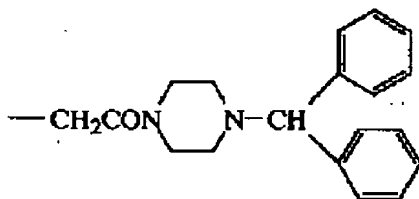
【表 446】

{Table 44 6 }

実施例 797

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

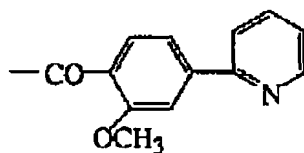
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 798

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム—ジエチルエーテル

形態 : 遊離

【1583】

{1583}

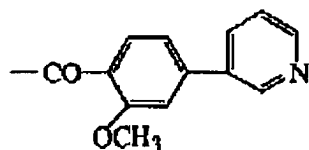
【表 447】

{Table 44 7 }

実施例 799

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

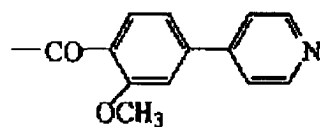
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 800

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : HR³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1584】

{1584}

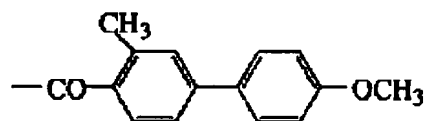
【表 448】

{Table 44 8 }

実施例 801

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

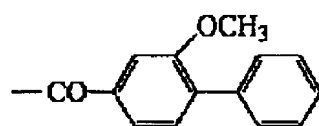
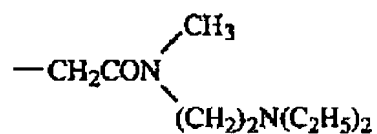
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 802

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1585】

{1585}

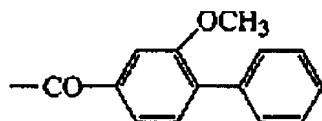
【表 449】

{Table 44 9 }

実施例 803

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

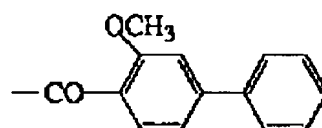
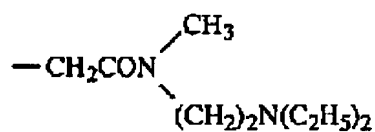
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 804

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

【1586】

{1586}

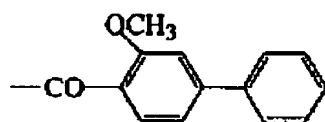
【表 450】

{Table 4 50 }

実施例 805

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

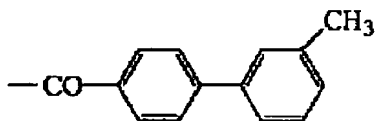
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 806

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1587】

{1587}

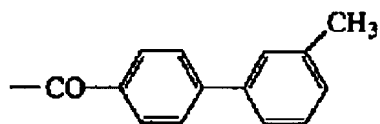
【表 451】

{Table 4 51 }

実施例 807

構造

R :

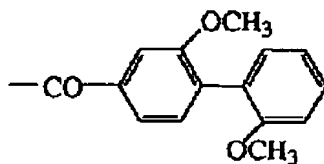
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 808

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1588】

{1588}

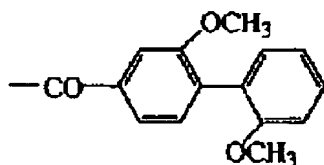
【表 452】

{Table 4 52 }

実施例 809

構造

R :

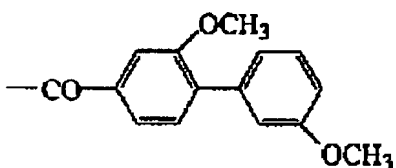
X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CONH(CH₂)₂N(C₂H₅)₂R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 810

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1589】

{1589}

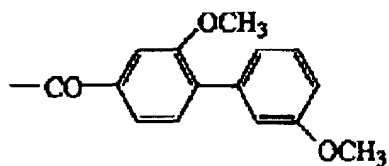
【表 453】

{Table 4 53 }

実施例 811

構造

R :

X : —CH₂—R¹ : 7-ClR² : —CH₂CONH(CH₂)₂N(C₂H₅)₂R³ : H

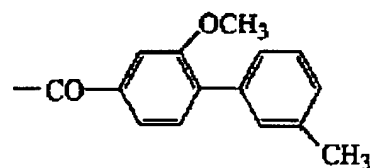
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 812

構造

R :

X : —CH₂—R¹ : 7-ClR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

JP1997221476A

1997-8-26

【1590】

{1590}

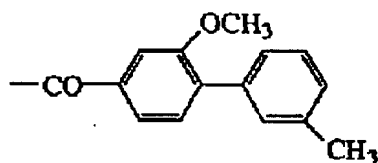
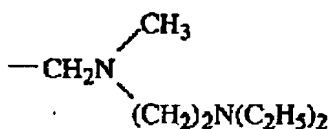
【表 454】

{Table 4 54 }

実施例 813

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² :R³ : H

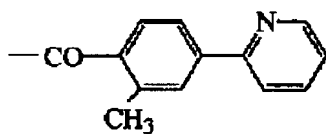
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 814

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : HCl

【1591】

{1591}

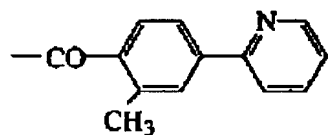
【表 455】

{Table 4 55 }

実施例 815

構造

R :

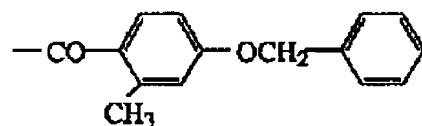
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

形態 : HCl

実施例 816

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

形態 : 遊離

【1592】

{1592}

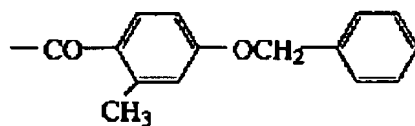
【表 456】

{Table 4 56 }

実施例 817

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$ $\text{R}^3 : \text{H}$

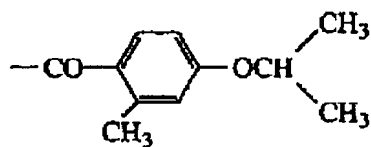
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 818

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ $\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 黄色粘稠油

形態 : 遊離

【1593】

{1593}

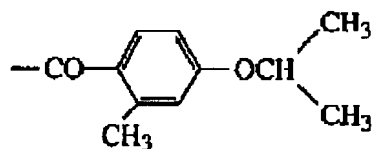
【表 457】

{Table 4 57 }

実施例 819

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

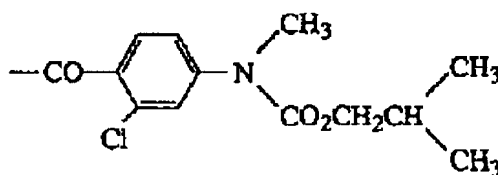
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 820

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

【1594】

{1594}

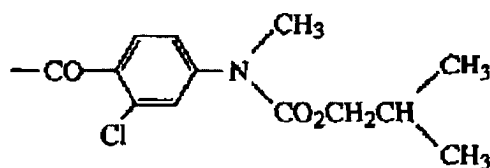
【表 458】

{Table 4 58 }

実施例 821

構造

R :

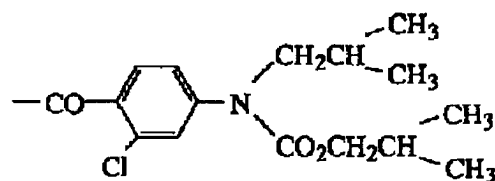
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 822

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

【1595】

{1595}

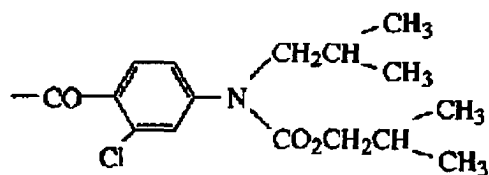
【表 459】

{Table 4 59 }

実施例 823

構造

R :

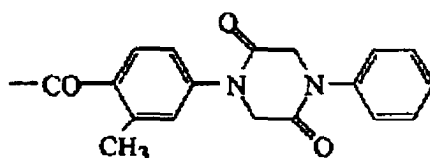
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

実施例 824

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【1596】

{1596}

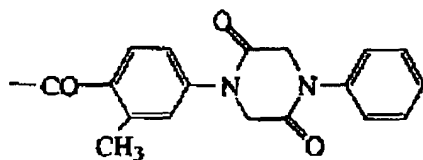
【表 460】

{Table 4 60 }

実施例 825

構造

R :

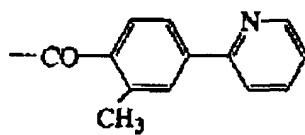
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 826

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

【1597】

{1597}

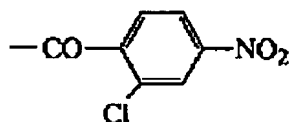
【表 461】

{Table 4 61 }

実施例 827

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CN}$ R³ : H

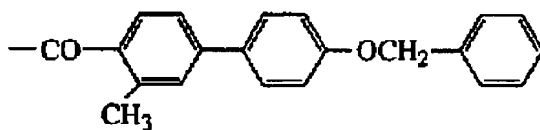
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 828

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

【1598】

{1598}

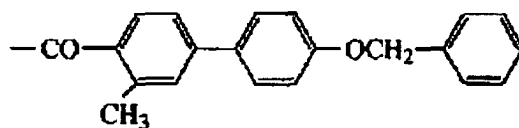
【表 462】

{Table 4 62 }

実施例 829

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : H R^3 : H

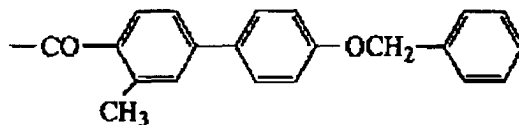
結晶形 : 淡黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 830

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 170°C

形態 : 遊離

【1599】

{1599}

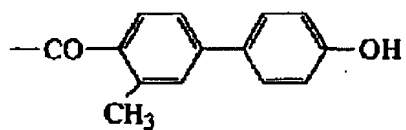
【表 463】

{Table 4 63 }

実施例 831

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : H R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

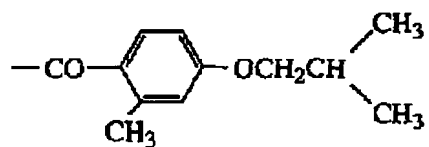
融点 : 177 - 178℃

形態 : 遊離

実施例 832

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 87 - 89℃

形態 : 遊離

[1600]

{1600}

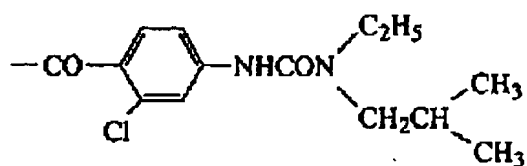
【表 464】

{Table 4 64 }

実施例 833

構造

R :

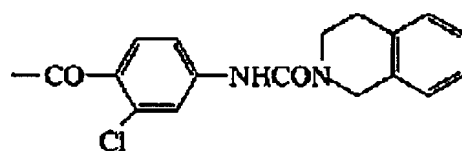
X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$ $\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 微黄色不定形
形態 : 遊離

実施例 834

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$ $\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【1601】

{1601}

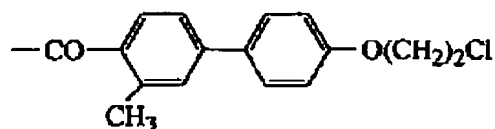
【表 465】

{Table 4 65 }

実施例 835

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : HR³ : H

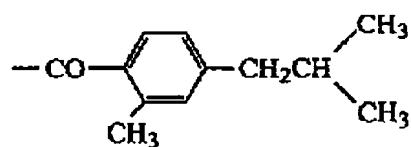
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 836

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 黄色油状物

形態 : 遊離

【1602】

{1602}

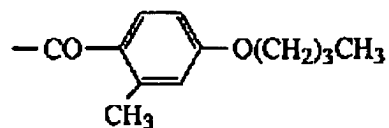
【表 466】

{Table 4 66 }

実施例 837

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

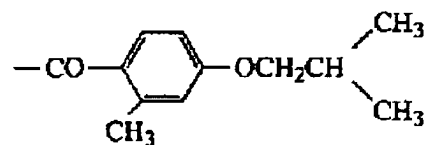
融点 : 99 - 101℃

形態 : 遊離

実施例 838

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1603】

{1603}

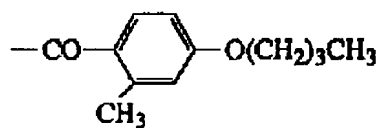
【表 467】

{Table 4 67 }

実施例 839

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

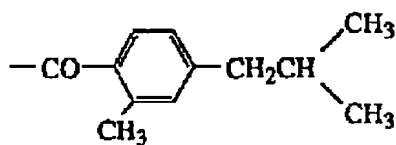
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 840

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1604】

{1604}

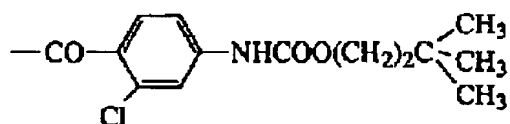
【表 468】

{Table 4 68 }

実施例 841

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ R³ : H

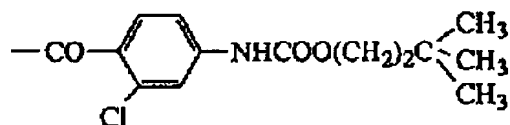
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 842

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

形態 : 遊離

【1605】

{1605}

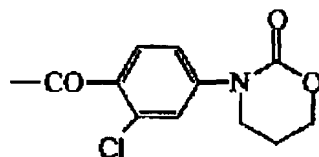
【表 469】

{Table 4 69 }

実施例 843

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R^3 : H

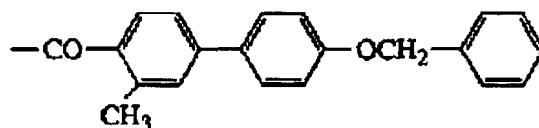
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 844

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1606】

{1606}

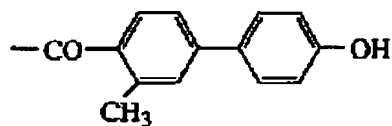
【表 470】

{Table 4 70 }

実施例 845

構造

R :

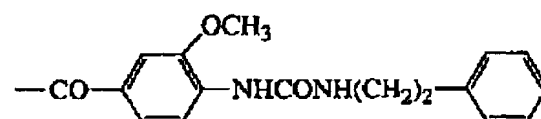
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² :R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 846

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン
融点 : 185 - 187℃
形態 : 遊離

【1607】

{1607}

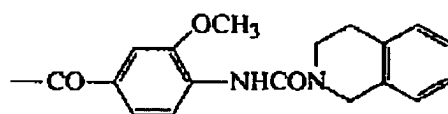
【表 471】

{Table 4 71 }

実施例 847

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

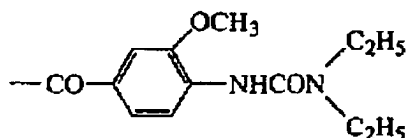
融点 : 148.5 - 150.5℃

形態 : 遊離

実施例 848

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 160 - 162℃

形態 : 遊離

[1608]

{1608}

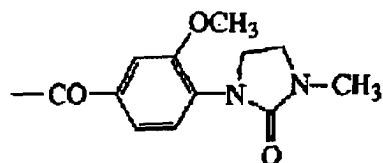
【表 472】

{Table 4 72 }

実施例 849

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

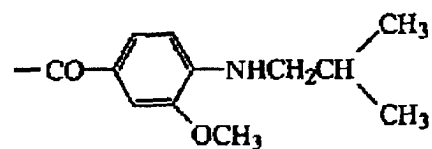
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 850

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 黄色油状

形態 : 遊離

【1609】

{1609}

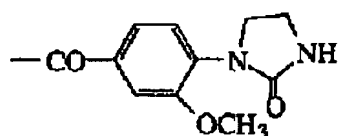
【表 473】

{Table 4 73 }

实施例 851

構造

R :

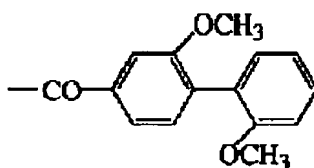
X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl R^2 : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R^3 : H

結晶形 : 微黄色不定形
形態 : 遊離

实施例 852

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl R^2 : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R^3 : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【1610】

{1610}

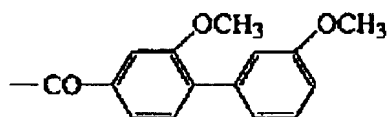
【表 474】

{Table 4 74 }

実施例 853

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

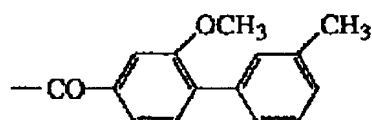
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 854

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂CO₂CH₃R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1611】

{1611}

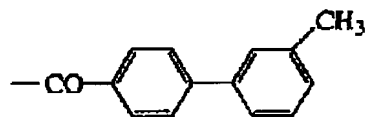
【表 475】

{Table 4 75 }

実施例 855

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

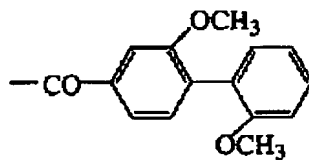
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 856

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1612】

{1612}

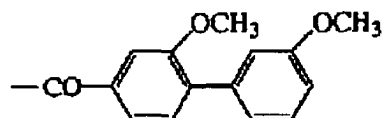
【表 476】

{Table 4 76 }

実施例 857

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

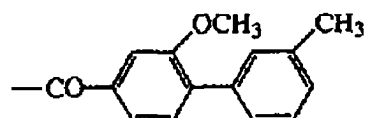
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 858

構造

R :

X : -CH₂-R¹ : 7-ClR² : -CH₂COOHR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1613】

{1613}

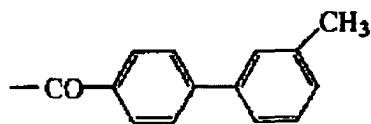
【表 477】

{Table 4 77 }

実施例 859

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

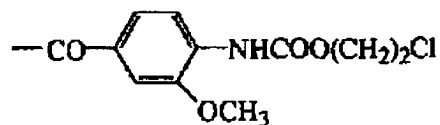
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 860

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

[1614]

{1614}

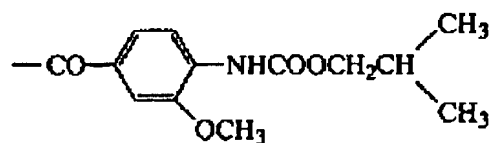
[表 478]

{Table 4 78 }

実施例 861

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

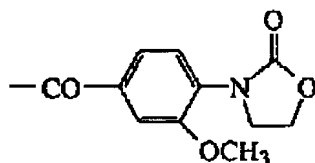
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 862

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1615】

{1615}

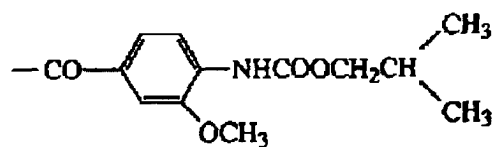
【表 479】

{Table 4 79 }

実施例 863

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

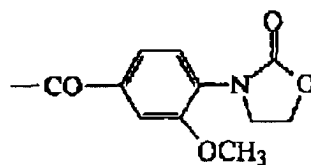
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 864

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

【1616】

{1616}

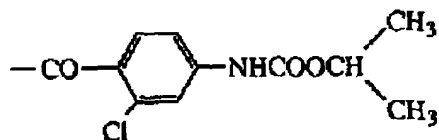
【表 480】

{Table 4 80 }

実施例 865

構造

R :

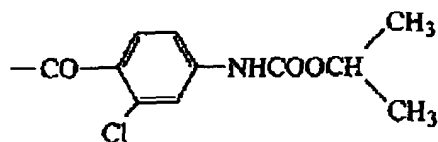
X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ R^3 : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 866

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R^3 : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【1617】

{1617}

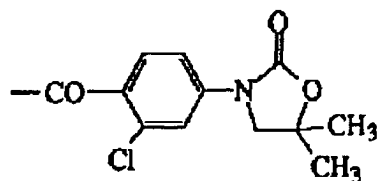
【表 481】

{Table 4 81 }

実施例 867

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテルより再結晶

形態 : 遊離

【1618】

適当な出発原料を用い、実施例 1 及び 2 と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【1619】

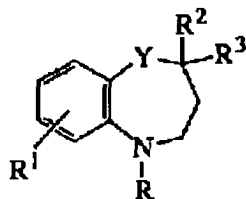
【表 482】

{1618}

compound which is stated in below-mentioned chart making use of suitable starting material, to similar to Working Example 1 and 2 was acquired.

{1619}

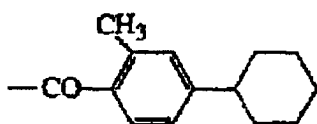
{Table 4 82 }



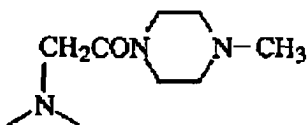
実施例 868

構造

R :



Y :

R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【1620】

{1620}

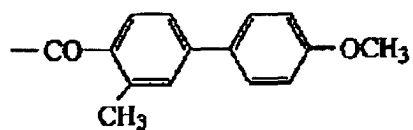
【表 483】

{Table 4 83 }

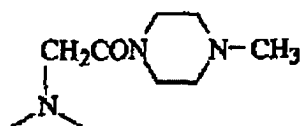
実施例 869

構造

R :



Y :

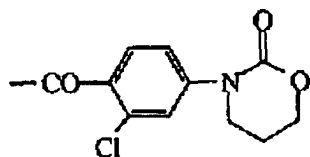
R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 870

構造

R :



Y :

R¹ : HR² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1621】

{1621}

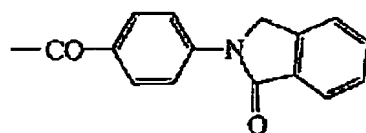
【表 484】

{Table 4 84 }

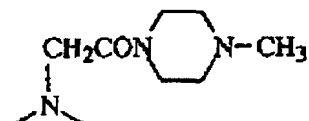
実施例 871

構造

R :



X :

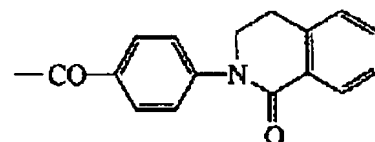
R¹ : HR² 及び R³: =O

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

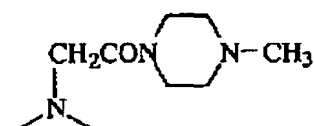
実施例 872

構造

R :



X :

R¹ : HR² 及び R³: =O

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 168 - 171℃
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1622】

{1622}

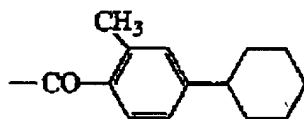
【表 485】

{Table 4 85 }

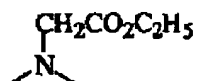
実施例 873

構造

R :



Y :

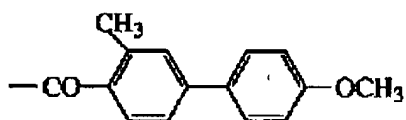
R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

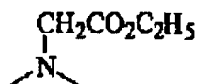
実施例 874

構造

R :



Y :

R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

JP1997221476A

1997-8-26

【1623】

{1623}

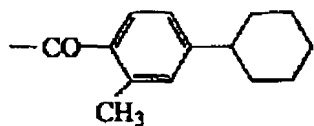
【表 486】

{Table 4 86 }

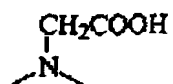
実施例 875

構造

R :



Y :

R¹ : HR² : HR³ : H

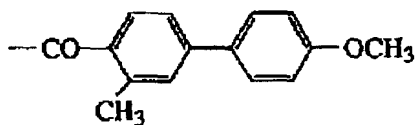
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

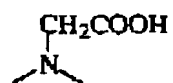
実施例 876

構造

R :



Y :

R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1624】

{1624}

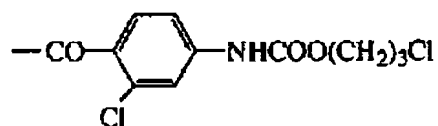
【表 487】

{Table 4 87 }

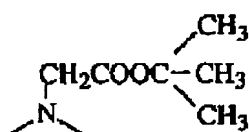
实施例 877

構造

R :



Y :


$$R^1 : H$$
$$R^2 \wedge U^* R^3: \quad \underline{\underline{=0}}$$

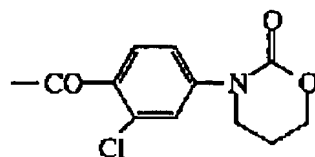
結晶形：黃色不定形

形態：遊離

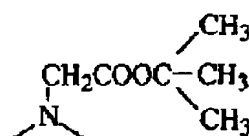
实施例 878

構造

R :



Y :


$$R^1 : H$$
$$R^2 \text{ 及 } U^* R^3: \quad = 0$$

結晶形：黃色不定形

形態：遊離

【1625】

{1625}

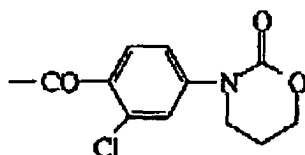
【表 488】

{Table 4 88 }

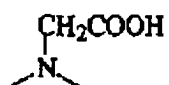
実施例 879

構造

R :



Y :

R¹ : HR² 及び R³ : =O

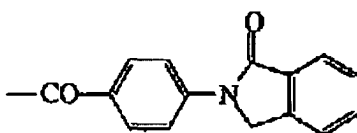
結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

実施例 880

構造

R :



Y :

R¹ : HR² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

【1626】

{1626}

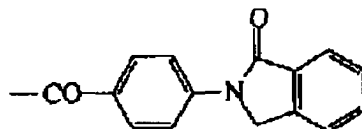
【表 489】

{Table 4 89 }

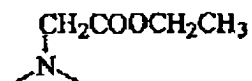
実施例 881

構造

R :



Y :

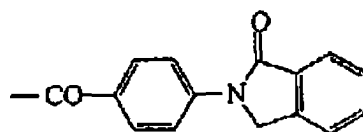
R¹ : HR² 及び R³: =O

結晶形 : 褐色油状
形態 : 遊離

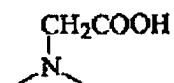
実施例 882

構造

R :



Y :

R¹ : HR² 及び R³: =O

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

【1627】

{1627}

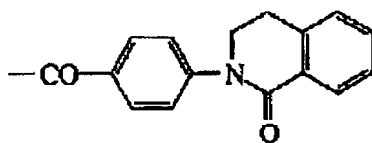
【表 490】

{Table 49 0 }

実施例 883

構造

R :



Y :

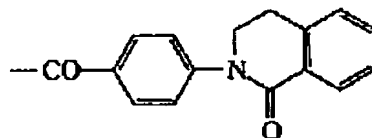
R¹ : HR² 及び R³ : =O

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

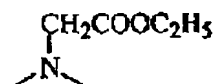
実施例 884

構造

R :



Y :

R¹ : HR² 及び R³ : =O

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

【1628】

{1628}

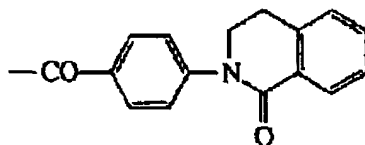
【表 491】

{Table 49 1 }

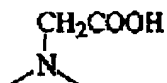
実施例 885

構造

R :



Y :

R¹ : HR² 及び R³: =O

結晶形 : 褐色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

形態 : 遊離

【1629】

{TRANSLATION STALLED}

上記で得られる各実施例化合物の NMR スペクトルは、次の通りである。

nmr spectrum of each Working Example compound which is acquired with description above seems following way.